

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro



INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM ÜBERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁷ : C07D 249/12, 239/10, 231/20, 253/08, 285/12, 263/58, 233/30, 237/32, A01N 43/653	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/05221 not. st (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 3. Februar 2000 (03.02.00)
---	----	---

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/04929
(22) Internationales Anmeldedatum: 13. Juli 1999 (13.07.99)
(30) Prioritätsdaten:
198 33 360.9 24. Juli 1998 (24.07.98) DE
199 21 732.7 11. Mai 1999 (11.05.99) DE
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen
(DE).
(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHWARZ, Hans-Georg
[DE/DE]; Stettiner Strasse 7a, D-40764 Langenfeld
(DE). MÜLLER, Klaus-Helmut [AT/DE]; Solfstrasse
19, D-40593 Düsseldorf (DE). LEHR, Stefan [DE/DE];
Ricarda-Huch-Strasse 38, D-40764 Langenfeld (DE).
SCHALLNER, Otto [DE/DE]; Noldeweg 22, D-40789
Monheim (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE];
Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld (DE). FEUCHT,
Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, D-40789 Monheim (DE).
PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am Kloster 69, D-42799 Le-
ichlingen (DE). WETCHOLOWSKY, Ingo [DE/BR]; Cond.
Estancia Marambaia, Rua Avare, 500, CEP-13280-000

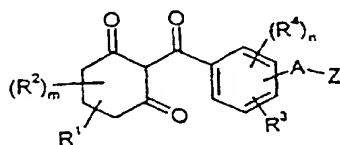
Vinhedo, SP (BR). WROBLOWSKY, Heinz-Jürgen
[DE/DE]; Virneburgstrasse 73, D-40764 Langenfeld (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG,
MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE,
SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN,
YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD,
SL, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG,
KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH,
CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.
Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen
eintreffen.

(54) Title: SUBSTITUTED BENZOYL CYCLOHEXANDIONES
(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE BENZOYL CYCLOHEXANDIONE



(57) Abstract

The invention relates to substituted benzoylcyclohexandiones of general formula (I), wherein A represents a single bond or alkane diyl (alkene) and Z represents an optionally substituted 4-12 membered, saturated or unsaturated, monocyclic or bicyclic, heterocyclic group containing 1-4 heteroatoms (up to 4 nitrogen atoms and optionally - alternatively or additively - an oxygen atom or a sulphur atom, or an SO group or an SO₂ group) and which additionally contains one to three oxo groups (C=O) and/or thioxo groups as constituents of the heterocycle. The invention also relates to a method for producing said substituted benzoylcyclohexandiones and to the use thereof as herbicides.

(57) Zusammenfassung

Substituierte Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I), in welcher A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht, Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO₂-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Le A 33 159

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
C	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

Substituierte Benzoylcyclohexandione

Die Erfindung betrifft neue substituierte Benzoylcyclohexandione. Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

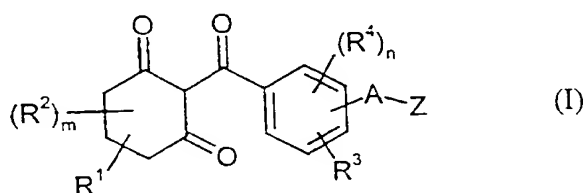
5

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte substituierte Benzoylcyclohexandione herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-090262, EP-A-135191, EP-A-186118, EP-A-186119, EP-A-186120, EP-A-319075, WO-A-96/26200, WO-A-97/46530, WO-A-99/07688). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch nicht in allen Be-

10

langen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I),



15

in welcher

m für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

20

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

A für eine Einfachbindung oder für Alkandiy l (Alkylen) steht,

25

R¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl steht,

R² für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht, oder zusammen mit R¹ für Alkandiyl (Alkylen) steht, wobei in diesem Fall m für 1 steht und R¹ und R² am gleichen Kohlenstoffatom („geminal“) oder an zwei benachbarten Kohlenstoffatomen („vicinal“) stehen,

R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

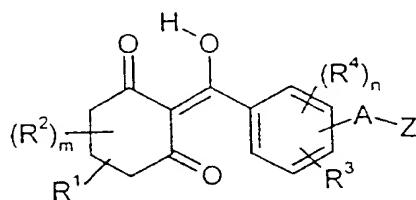
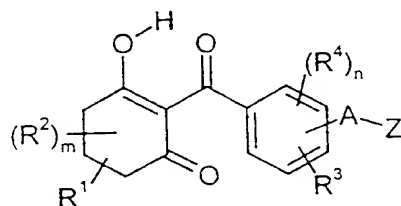
R⁴ Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und

Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO₂-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,

- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) - gefunden.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkandiyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

Neben den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) - oben - können immer auch die entsprechenden tautomeren Formen - nachstehend beispielhaft dargestellt - vorliegen.



5

Bevorzugte Substituenten der in den vorstehend gezeigten Formeln aufgeführten Reste werden im folgenden erläutert:

10 m steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1 oder 2.

n steht bevorzugt für die Zahlen 0, 1 oder 2.

15 A steht bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

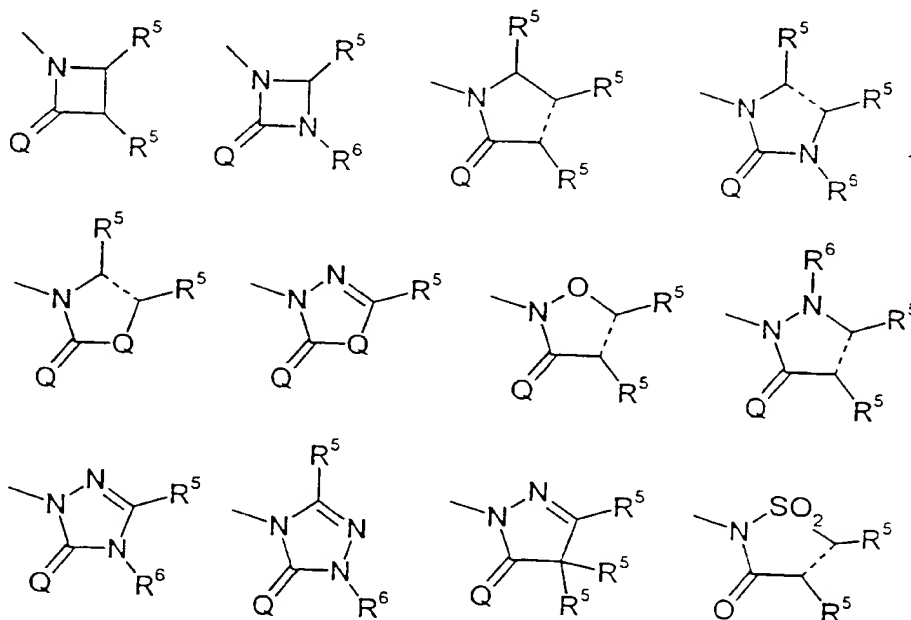
20 R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für Alkoxy-carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen.

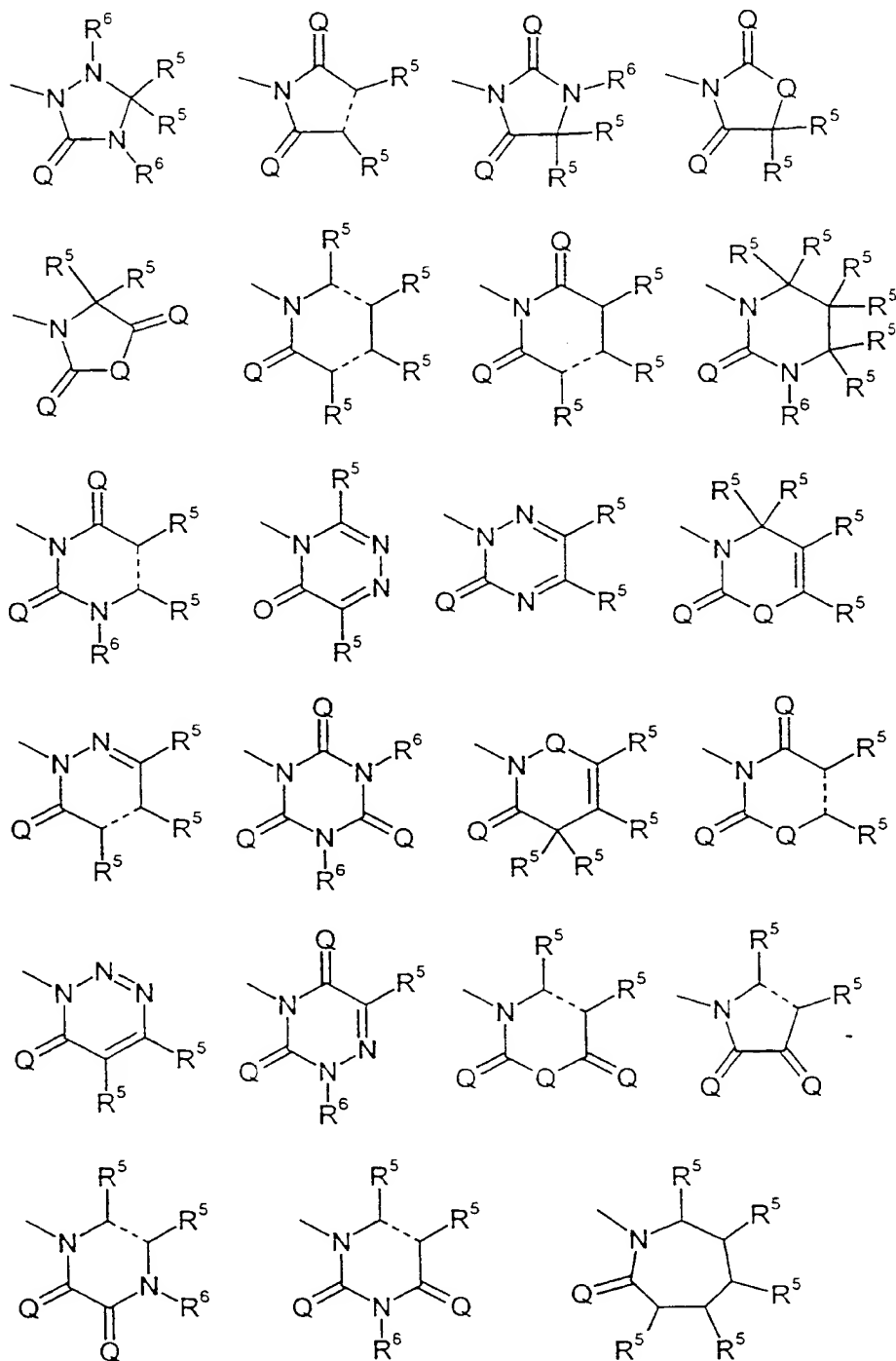
25 R² steht bevorzugt für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder zusammen mit R¹ für Alkandiyl (Alkylen) mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, wobei in diesem Fall m für 1 steht und R¹ und R² am gleichen Kohlenstoffatom („geminal“) oder an zwei benachbarten Kohlenstoffatomen („vicinal“) stehen.

R^3 steht bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

R^4 steht bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen.

Z steht bevorzugt für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen





5

worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht.

5 R⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für Propadienylthio, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylalkylthio oder Cycloalkylalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht, für Pyrrolidino, Piperidino oder Morpholino steht, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R⁵ und R⁵ sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R⁵ auch für eine Benzogruppierung steht, und

30 R⁶ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen sub-

5 stituiertes Alkenyl, Alkynyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R⁵ oder R⁶ für gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Alkan-
10 diyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die einzelnen Reste R⁵ und R⁶ – soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

15

A steht besonders bevorzugt für eine Einfachbindung, Methylen, Ethylen (Ethan-1,1-diyl) oder Dimethylen (Ethan-1,2-diyl).

20

R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, oder für Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl.

25

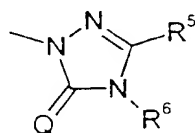
R² steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder zusammen mit R¹ für Methylen, Ethan-1,1-diyl (Ethylen, -CH(CH₃)-), Ethan-1,2-diyl (Dimethylen, -CH₂CH₂-), Propan-1,3-diyl (Trimethylen, -CH₂CH₂CH₂-), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen, -CH₂CH₂CH₂CH₂-) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-), wobei in diesem Fall m für 1
30

steht und R^1 und R^2 am gleichen Kohlenstoffatom („geminal“) oder an zwei benachbarten Kohlenstoffatomen („vicinal“) stehen.

5 R^3 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

20 R^4 steht besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl.

30 Z steht besonders bevorzugt für die nachstehende heterocyclische Gruppierung



- R⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopropylmethylthio, Cyclobutylmethylthio, Cyclopentylmethylthio, Cyclohexylmethylthio, Cyclopropylmethylamino, Cyclobutylmethylamino, Cyclopentylmethylamino oder Cyclohexylmethylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Phenylthio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino, oder - für den Fall, daß

zwei benachbarte Reste R^5 und R^5 sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^5 auch für eine Benzogruppierung.

5 R^6 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl, oder zusammen mit einem
10 benachbarten Rest R^5 oder R^6 für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1-5-diyl (Pentamethylen),
15

20 wobei die einzelnen Reste R^5 und R^6 - soweit mehrere davon an gleiche heterocyclische Gruppierungen gebunden sind, gleiche oder verschiedene Bedeutungen im Rahmen der obigen Definition haben können.

A steht ganz besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Methylen.

25 R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.

R^2 steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.

30 R^3 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthio-

methyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

5 R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

10

15 R⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Fluor-n-propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Fluorethoxy, Chlorethoxy, Difluorethoxy, Dichlorethoxy, Trifluorethoxy, Trichlorethoxy, Chlorfluorethoxy, Chlordifluorethoxy, Fluordichlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Fluorethylthio, Chlorethylthio, Difluorethylthio, Dichlorethylthio, Chlorfluorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Dimethylamino, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio, Butinylthio, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Phenyl
20 oder Phenoxy.
25

30 R⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Amino, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylamino, Dimethylamino, Cyclopropyl oder Cyclopropylmethyl steht, oder zusammen mit R⁵ für Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen).

A steht am meisten bevorzugt für Methylen.

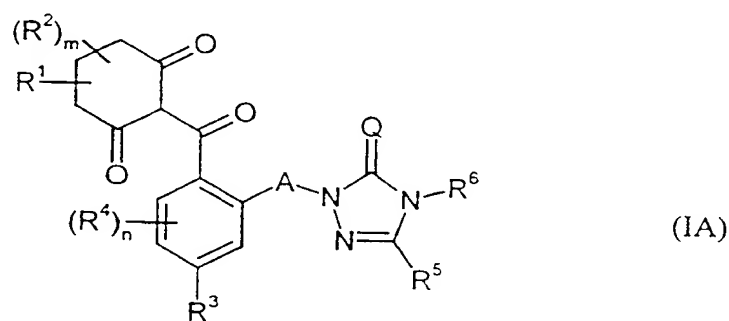
Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise die Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C₁-C₄-Alkyl-ammonium-, Di-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium-, Tetra-(C₁-C₄-alkyl)-ammonium, Tri-(C₁-C₄-alkyl)-sulfonium-, C₅- oder C₆-Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C₁-C₂-alkyl)-benzyl-ammonium-Salze der Verbindungen der Formel (I), in welcher m, n, A, R¹, R², R³, R⁴ und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben.

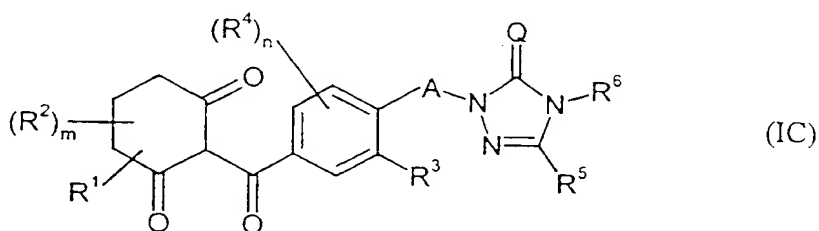
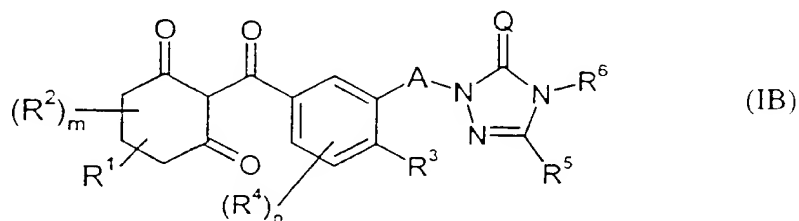
Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I) in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Verbindungen der folgenden allgemeinen Formeln (IA), (IB) und (IC) werden insbesondere als erfindungsgemäß hervorgehoben:





in welchen

5

m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

10

A steht besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für Methylen.

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht.

15

R² für Methyl steht,

R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Tri-
fluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl,
Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy,
20 Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethyl-
sulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

R⁴ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

R⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Fluorethyl, Chlorethyl, Difluorethyl, Dichlorethyl, Fluor-n-propyl, Fluor-i-propyl, Chlor-n-propyl, Chlor-i-propyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Fluorethoxy, Chlorethoxy, Difluorethoxy, Dichlorethoxy, Trifluorethoxy, Trichlorethoxy, Chlorfluorethoxy, Chlordifluorethoxy, Fluordichlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Fluorethylthio, Chlorethylthio, Difluorethylthio, Dichlorethylthio, Chlorfluorethylthio, Chlordifluorethylthio, Fluordichlorethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Dimethylamino, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio, Butinylthio, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Phenyl oder Phenoxy steht, und

R⁶ für Amino, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, Methylamino, Dimethylamino, Cyclopropyl oder Cyclopropylmethyl steht, oder zusammen mit R⁵ für Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen) steht.

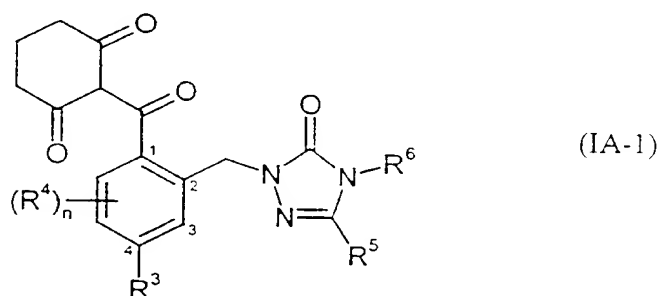
Die Verbindungen der Formel (IA), bei welchen A für Methylen steht, werden hierbei ganz besonders hervorgehoben.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend

für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- oder Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

- 5 Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

Gruppe 1











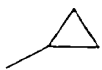

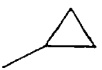
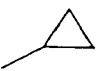
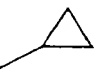

10

R^3 , $(R^4)_n$, R^5 und R^6 haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:

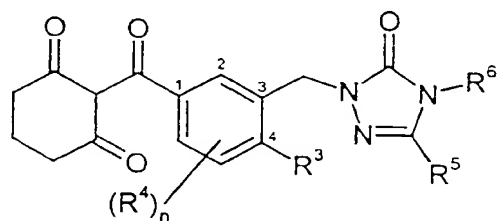
R^3	(Position-) $(R^4)_n$	R^5	R^6
H	-	CF_3	CH_3
F	-	CF_3	CH_3
Cl	-	CF_3	CH_3
Br	-	CF_3	CH_3
I	-	CF_3	CH_3
NO_2	-	CF_3	CH_3
CN	-	CF_3	CH_3
CH_3	-	CF_3	CH_3
OCH_3	-	CF_3	CH_3
CF_3	-	CF_3	CH_3
$OCHF_2$	-	CF_3	CH_3
OCF_3	-	CF_3	CH_3
SO_2CH_3	-	CF_3	CH_3

R ³	(Position-)(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
H	-	OCH ₃	CH ₃
F	-	OCH ₃	CH ₃
Cl	-	OCH ₃	CH ₃
Br	-	OCH ₃	CH ₃
I	-	OCH ₃	CH ₃
NO ₂	-	OCH ₃	CH ₃
CN	-	OCH ₃	CH ₃
CH ₃	-	OCH ₃	CH ₃
OCH ₃	-	OCH ₃	CH ₃
CF ₃	-	OCH ₃	CH ₃
OCHF ₂	-	OCH ₃	CH ₃
OCF ₃	-	OCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	OCH ₃	CH ₃
H	-	SCH ₃	CH ₃
F	-	SCH ₃	CH ₃
Cl	-	SCH ₃	CH ₃
Br	-	SCH ₃	CH ₃
I	-	SCH ₃	CH ₃
NO ₂	-	SCH ₃	CH ₃
CN	-	SCH ₃	CH ₃
CH ₃	-	SCH ₃	CH ₃
OCH ₃	-	SCH ₃	CH ₃
CF ₃	-	SCH ₃	CH ₃
OCHF ₂	-	SCH ₃	CH ₃
OCF ₃	-	SCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	SCH ₃	CH ₃
H	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
F	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
Cl	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
Br	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
I	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
NO ₂	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
CN	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
CH ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃

R ³	(Position-)(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
OCH ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
CF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
OCHF ₂	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
OCF ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	OC ₂ H ₅	CH ₃
H	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
F	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Cl	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Br	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
I	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
NO ₂	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CN	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CH ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
OCH ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CF ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
OCHF ₂	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
OCF ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
SO ₂ CH ₃	-	N(CH ₃) ₂	CH ₃
H	-	OCH ₃	
F	-	OCH ₃	
Cl	-	OCH ₃	
Br	-	OCH ₃	
I	-	OCH ₃	
NO ₂	-	OCH ₃	
CN	-	OCH ₃	
CH ₃	-	OCH ₃	

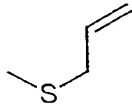
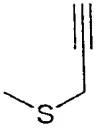
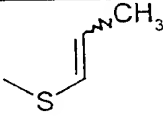
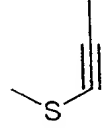
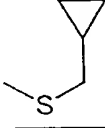
R ³	(Position-)(R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶
OCH ₃	-	OCH ₃	
CF ₃	-	OCH ₃	
OCHF ₂	-	OCH ₃	
OCF ₃	-	OCH ₃	
SO ₂ CH ₃	-	OCH ₃	
H	(3-) Cl	CF ₃	CH ₃
F	(3-) Cl	CH ₃	CH ₃
Cl	(3-) Cl	OCH ₃	CH ₃
Br	(3-) Cl	Br	
Cl	(3-) Cl	CF ₃	CH ₃
NO ₂	(3-) Cl	CH ₃	CH ₃
Cl	(3-) Cl	SCH ₃	CH ₃
CH ₃	(3-) Cl	Cl	CH ₃
OCH ₃	(3-) Cl	OCH ₃	CH ₃
CF ₃	(3-) Cl	CF ₃	CH ₃
OCHF ₂	(3-) Cl	CH ₃	CH ₃
OCF ₃	(3-) Cl	CH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(3-) Cl	OCH ₃	CH ₃

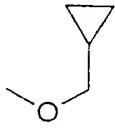

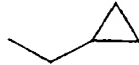
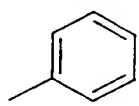
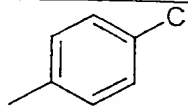
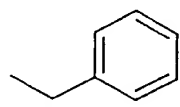
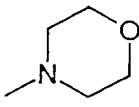
Gruppe 2

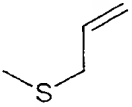
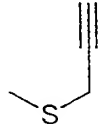
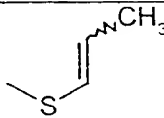
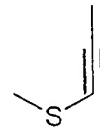
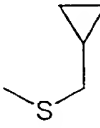
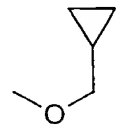



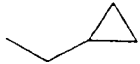
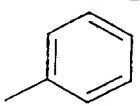
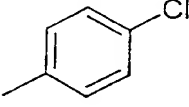
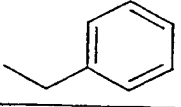
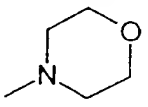
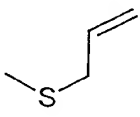
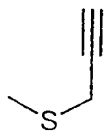
(IB-1)

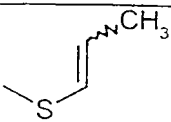
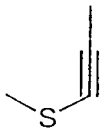
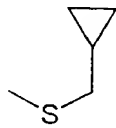
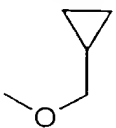

R^3 , $(R^4)_n$, R^5 und R^6 haben hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Tabelle angegebenen Bedeutungen:


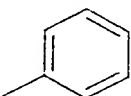
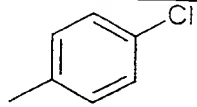
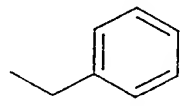
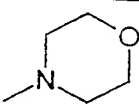

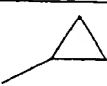
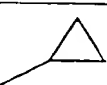
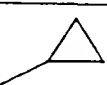
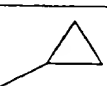
R^3	(Position-) $(R^4)_n$	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl	CF_3	CH_3
Cl	(2-) Cl	SCH_3	CH_3
Cl	(2-) Cl	SC_2H_5	CH_3
Cl	(2-) Cl	SC_3H_7	CH_3
Cl	(2-) Cl	SC_3H_7-i	CH_3
Cl	(2-) Cl		CH_3
Cl	(2-) Cl		CH_3
Cl	(2-) Cl		CH_3
Cl	(2-) Cl		CH_3
Cl	(2-) Cl		CH_3
Cl	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	CH_3
Cl	(2-) Cl	SCH_2CN	CH_3
Cl	(2-) Cl	SCH_2CH_2CN	CH_3
Cl	(2-) Cl	OCH_3	CH_3
Cl	(2-) Cl	OC_2H_5	CH_3
Cl	(2-) Cl	OC_3H_7	CH_3
Cl	(2-) Cl	OC_3H_7-i	CH_3
Cl	(2-) Cl	OC_4H_9	CH_3
Cl	(2-) Cl	OCH_2CF_3	CH_3

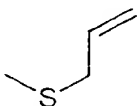

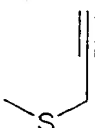

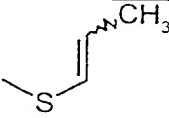

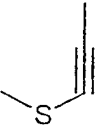
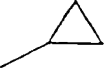
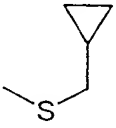




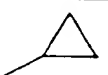
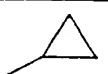

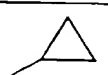
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl	OC ₆ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) Cl	H	CH ₃
Cl	(2-) Cl	CH ₃	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₂ H ₅	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇ -i	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -i	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -s	CH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₄ H ₉ -t	CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl	CH=CHCH ₃	CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Cl	(2-) Cl		CH ₃
Cl	(2-) Cl	Cl	CH ₃
Cl	(2-) Cl	Br	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CF ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	CH ₃

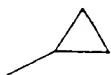
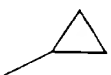
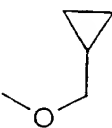


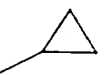





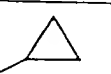
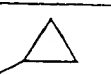
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_3H_7	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_3H_7-i	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_2CN	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_2CH_2CN	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OCH_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_2H_5	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_3H_7	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_3H_7-i	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_4H_9	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OCH_2CF_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_6H_5	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	H	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	CH_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_2H_5	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_3H_7	CH_3


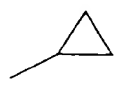

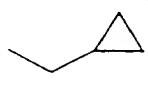


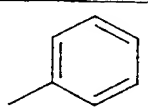

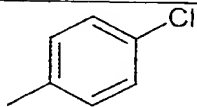

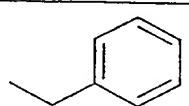


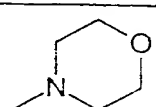




R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_4H_9	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-i}$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-s}$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-t}$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl		CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	Cl	CH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	Br	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	CF_3	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_3	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_2H_5	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_3H_7	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{SC}_3\text{H}_7\text{-i}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3

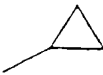



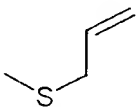

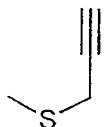

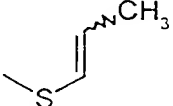
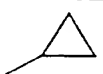
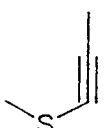
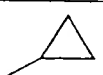
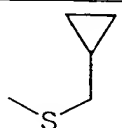
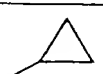
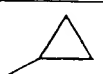
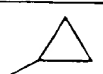
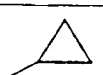
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{SCH}=\text{C}=\text{CH}_2$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_2CN	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OCH_3	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_2H_5	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_3H_7	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{OC}_3\text{H}_7\text{-i}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_4H_9	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OCH_2CF_3	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_6H_5	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	H	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	CH_3	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_2H_5	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_3H_7	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_4H_9	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-i}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-s}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-t}$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3

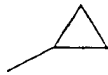

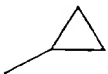


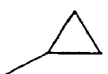
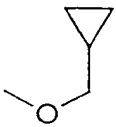


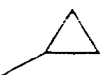

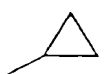

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3		CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	Cl	CH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	Br	CH_3
Cl	(2-) Cl	CF_3	
Cl	(2-) Cl	SCH_3	
Cl	(2-) Cl	SC_2H_5	
Cl	(2-) Cl	SC_3H_7	
Cl	(2-) Cl	$\text{SC}_3\text{H}_7\text{-i}$	



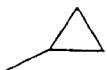
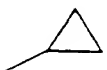
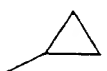




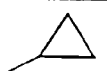
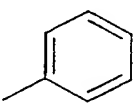
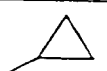
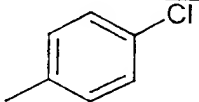

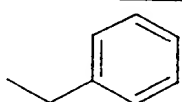

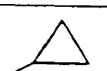
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	
Cl	(2-) Cl	SCH_2CN	
Cl	(2-) Cl	SCH_2CH_2CN	
Cl	(2-) Cl	OCH_3	
Cl	(2-) Cl	OC_2H_5	
Cl	(2-) Cl	OC_3H_7	
Cl	(2-) Cl	OC_3H_7-i	

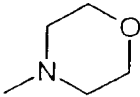


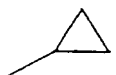
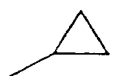
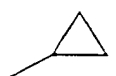
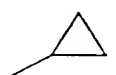
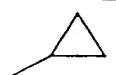

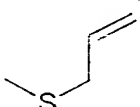

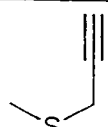
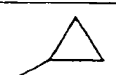
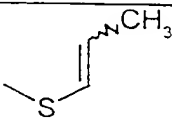
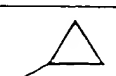
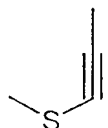

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl	OC_4H_9	
Cl	(2-) Cl	OCH_2CF_3	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	OC_6H_5	
Cl	(2-) Cl	H	
Cl	(2-) Cl	CH_3	
Cl	(2-) Cl	C_2H_5	
Cl	(2-) Cl	C_3H_7	
Cl	(2-) Cl	C_3H_7-i	
Cl	(2-) Cl	C_4H_9	
Cl	(2-) Cl	C_4H_9-i	
Cl	(2-) Cl	C_4H_9-s	

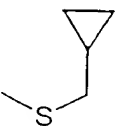
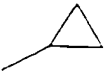


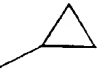






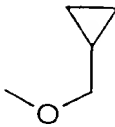


R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl	C_4H_9-t	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	$CH=CHCH_3$	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	
Cl	(2-) Cl		
Cl	(2-) Cl	Cl	
Cl	(2-) Cl	Br	
SO_2CH_3	(2-) Cl	CF_3	










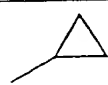

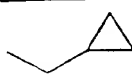


R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_3	
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_2H_5	
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_3H_7	
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_3H_7-i	
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_2CN	
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_2CH_2CN	

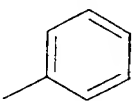

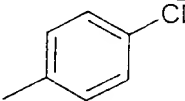
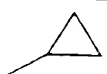
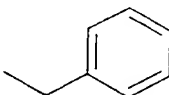


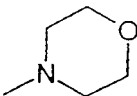



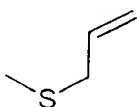
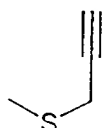
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	OCH_3	
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_2H_5	
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_3H_7	
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_3H_7-i	
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_4H_9	
SO_2CH_3	(2-) Cl	OCH_2CF_3	
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_6H_5	
SO_2CH_3	(2-) Cl	H	
SO_2CH_3	(2-) Cl	CH_3	
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_2H_5	
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_3H_7	

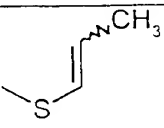
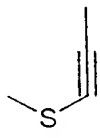
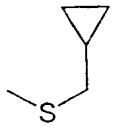
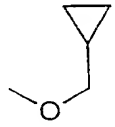
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_4H_9	
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-i}$	
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-s}$	
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-t}$	
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{CH}=\text{CHCH}_3$	
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	


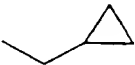
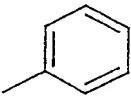
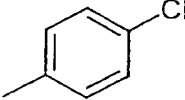
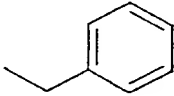
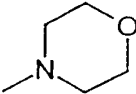
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl		
SO_2CH_3	(2-) Cl	Cl	
SO_2CH_3	(2-) Cl	Br	
Cl	(2-) SO_2CH_3	CF_3	
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_3	
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_2H_5	
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_3H_7	
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_3H_7-i	
Cl	(2-) SO_2CH_3		
Cl	(2-) SO_2CH_3		
Cl	(2-) SO_2CH_3		
Cl	(2-) SO_2CH_3		

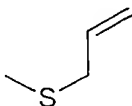
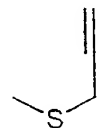
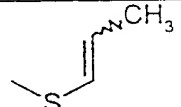
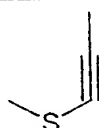
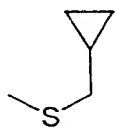
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO_2CH_3		
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{SCH}=\text{CH}_2$	
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_2CN	
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	
Cl	(2-) SO_2CH_3	OCH_3	
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_2H_5	
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_3H_7	
Cl	(2-) SO_2CH_3	$\text{OC}_3\text{H}_7\text{-i}$	
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_4H_9	
Cl	(2-) SO_2CH_3	OCH_2CF_3	
Cl	(2-) SO_2CH_3		
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_6H_5	

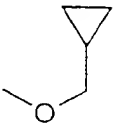

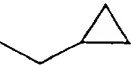
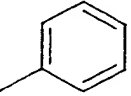
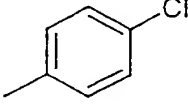
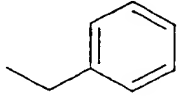
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	H	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇ -i	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -i	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -s	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -t	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH=CHCH ₃	

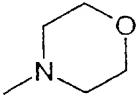
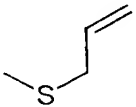
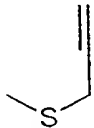
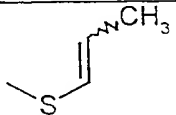
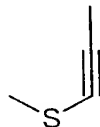
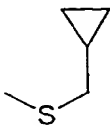
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Cl	
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	
Cl	(2-) Cl	CF ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	SCH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	SC ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	SC ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl		N(CH ₃) ₂

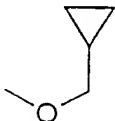

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	SCH_2CN	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	SCH_2CH_2CN	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OCH_3	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OC_2H_5	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OC_3H_7	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OC_3H_7-i	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OC_4H_9	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OCH_2CF_3	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	OC_6H_5	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	H	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	CH_3	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	C_2H_5	$N(CH_3)_2$

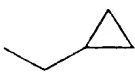
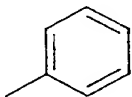
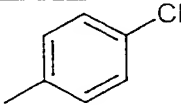
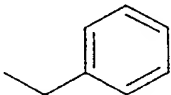
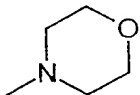
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl	C_3H_7	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	C_3H_7-i	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	C_4H_9	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	C_4H_9-i	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	C_4H_9-s	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	C_4H_9-t	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$CH=CHCH_3$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	Cl	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) Cl	Br	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	CF_3	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_3	$N(CH_3)_2$

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_2H_5	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_3H_7	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	SC_3H_7-i	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	$SCH=C=CH_2$	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_2CN	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	SCH_2CH_2CN	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	OCH_3	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_2H_5	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_3H_7	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_3H_7-i	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_4H_9	$N(CH_3)_2$

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	OCH_2CF_3	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	OC_6H_5	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	H	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	CH_3	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_2H_5	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_3H_7	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_3H_7-i	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_4H_9	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_4H_9-i	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_4H_9-s	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	C_4H_9-t	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	$CH=CHCH_3$	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO_2CH_3	(2-) Cl	$N(CH_3)_2$	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl		$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	Cl	$N(CH_3)_2$
SO_2CH_3	(2-) Cl	Br	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	CF_3	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_3	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_2H_5	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_3H_7	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_3H_7-i	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3		$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	$SCH=C=CH_2$	$N(CH_3)_2$
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_2CN	$N(CH_3)_2$

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₂ CN	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₄ H ₉	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	OC ₆ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	H	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₃ H ₇ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -i	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -s	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	C ₄ H ₉ -t	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	CH=CHCH ₃	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃		N(CH ₂) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Cl	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	N(CH ₃) ₂
Cl	(2-) Cl	CH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	SCH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	OCH ₃	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	OCH ₃
Cl	(2-) Cl	CH ₃	OC ₂ H ₅
Cl	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Cl	(2-) Cl	C_3H_7	OC_2H_5
Cl	(2-) Cl	SCH_3	OC_2H_5
Cl	(2-) Cl	SC_2H_5	OC_2H_5
Cl	(2-) Cl	OCH_3	OC_2H_5
Cl	(2-) Cl	OC_2H_5	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	CH_3	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_2H_5	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_3H_7	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_3	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_2H_5	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OCH_3	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_2H_5	OCH_3
Cl	(2-) SO_2CH_3	CH_3	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_2H_5	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	C_3H_7	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	SCH_3	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	SC_2H_5	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	OCH_3	OC_2H_5
Cl	(2-) SO_2CH_3	OC_2H_5	OC_2H_5
SO_2CH_3	(2-) Cl	Cl	OCH_3
SO_2CH_3	(2-) Cl	Br	OCH_3

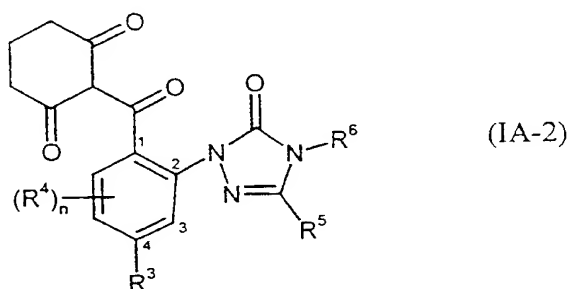
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	OCH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	CH ₃	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	C ₃ H ₇	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SCH ₃	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	SC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅
SO ₂ CH ₃	(2-) Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅
CF ₃	(2-) Cl	Br	CH ₃
CF ₃	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃
CF ₃	(2-) Cl	OCH ₃	CH ₃
CF ₃	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CF ₃	(2-) Cl	CF ₃	CH ₃
CF ₃	(2-) NO ₂	Br	CH ₃
CF ₃	(2-) NO ₂	SCH ₃	CH ₃
CF ₃	(2-) NO ₂	OCH ₃	CH ₃

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
CF_3	(2-) NO_2	$N(CH_3)_2$	CH_3
CF_3	(2-) NO_2	CF_3	CH_3
CF_3	(2-) CH_3	Br	CH_3
CF_3	(2-) CH_3	SCH_3	CH_3
CF_3	(2-) CH_3	OCH_3	CH_3
CF_3	(2-) CH_3	$N(CH_3)_2$	CH_3
CF_3	(2-) CH_3	CF_3	CH_3
CF_3	(2-) OCH_3	Br	CH_3
CF_3	(2-) OCH_3	SCH_3	CH_3
CF_3	(2-) OCH_3	OCH_3	CH_3
CF_3	(2-) OCH_3	$N(CH_3)_2$	CH_3
CF_3	(2-) OCH_3	CF_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) NO_2	Br	CH_3
SO_2CH_3	(2-) NO_2	SCH_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) NO_2	OCH_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) NO_2	$N(CH_3)_2$	CH_3
SO_2CH_3	(2-) NO_2	CF_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) CF_3	Br	CH_3
SO_2CH_3	(2-) CF_3	SCH_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) CF_3	OCH_3	CH_3
SO_2CH_3	(2-) CF_3	$N(CH_3)_2$	CH_3

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
SO ₂ CH ₃	(2-) CF ₃	CF ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃
SO ₂ CH ₃	(2-) SO ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
CN	(2-) Cl	Br	CH ₃
CN	(2-) Cl	SCH ₃	CH ₃
CN	(2-) Cl	OCH ₃	CH ₃
CN	(2-) Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CN	(2-) Cl	CF ₃	CH ₃
CN	(2-) NO ₂	Br	CH ₃
CN	(2-) NO ₂	SCH ₃	CH ₃
CN	(2-) NO ₂	OCH ₃	CH ₃
CN	(2-) NO ₂	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CN	(2-) NO ₂	CF ₃	CH ₃
CN	(2-) CF ₃	Br	CH ₃
CN	(2-) CF ₃	SCH ₃	CH ₃
CN	(2-) CF ₃	OCH ₃	CH ₃
CN	(2-) CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CN	(2-) CF ₃	CF ₃	CH ₃

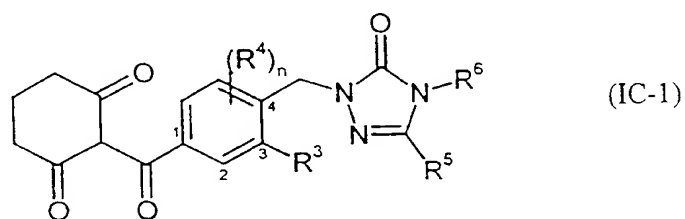
R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
CN	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	CH ₃
CN	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	CH ₃
CN	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃
CN	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃
CN	(2-) SO ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
Br	(2-) NO ₂	Br	CH ₃
Br	(2-) NO ₂	SCH ₃	CH ₃
Br	(2-) NO ₂	OCH ₃	CH ₃
Br	(2-) NO ₂	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Br	(2-) NO ₂	CF ₃	CH ₃
Br	(2-) CF ₃	Br	CH ₃
Br	(2-) CF ₃	SCH ₃	CH ₃
Br	(2-) CF ₃	OCH ₃	CH ₃
Br	(2-) CF ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Br	(2-) CF ₃	CF ₃	CH ₃
Br	(2-) SO ₂ CH ₃	Br	CH ₃
Br	(2-) SO ₂ CH ₃	SCH ₃	CH ₃
Br	(2-) SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃
Br	(2-) SO ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	CH ₃
Br	(2-) SO ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
Br	(2-) CH ₃	Br	CH ₃

R^3	(Position-)(R^4) _n	R^5	R^6
Br	(2-) CH_3	SCH_3	CH_3
Br	(2-) CH_3	OCH_3	CH_3
Br	(2-) CH_3	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	CH_3
Br	(2-) CH_3	CF_3	CH_3

Gruppe 3

5

R^3 , $(R^4)_n$, R^5 und R^6 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

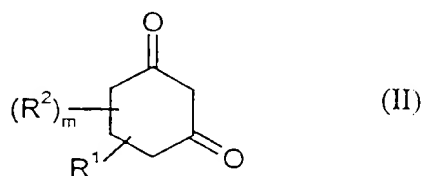
10 Gruppe 4

15

R^3 , $(R^4)_n$, R^5 und R^6 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 2 angegebenen Bedeutungen.

Die neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

- 5 Man erhält die neuen substituierten Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I), wenn man 1,3-Cyclohexandion oder dessen Derivate der allgemeinen Formel (II),

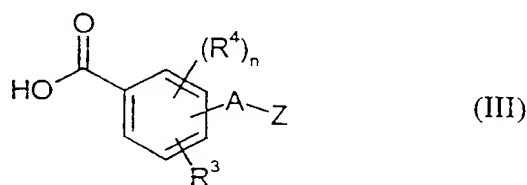


in welcher

10

m, R¹ und R² die oben angegebene Bedeutung haben,

mit substituierten Benzoessäuren der allgemeinen Formel (III),



15

in welcher

n, A, R³, R⁴ und Z die oben angegebene Bedeutung haben,

- 20 in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt,

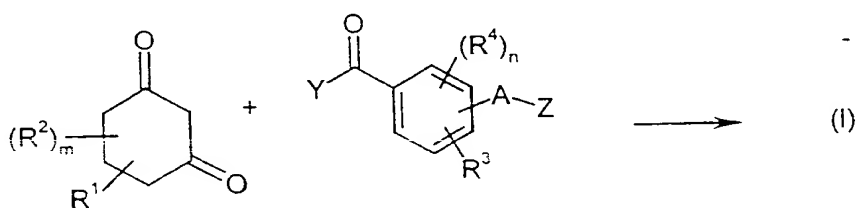
- 25 und gegebenenfalls im Anschluß daran an den so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile

oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt oder die Verbindungen der Formel (I) auf übliche Weise in Salze überführt.

Die Verbindungen der Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden. beispielsweise durch nucleophile Substitution (z.B. $R^5: Cl \rightarrow OC_2H_5, SCH_3$) oder durch Oxidation (z.B. $R^5: CH_2SCH_3 \rightarrow CH_2S(O)CH_3$).

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können prinzipiell auch wie im Folgenden schematisch dargestellt synthetisiert werden:

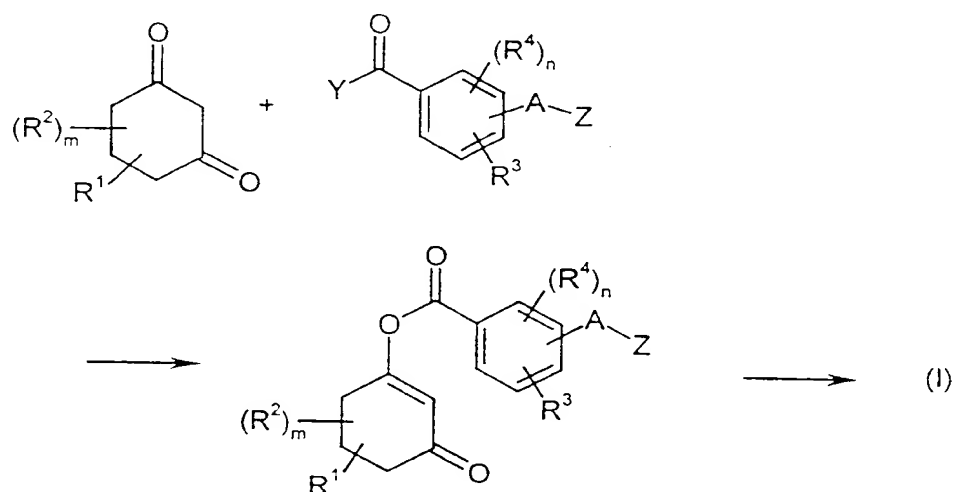
Umsetzung von 1,3-Cyclohexandion oder dessen Derivaten der allgemeinen Formel (II) - oben - mit reaktiven Derivaten der substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III) - oben - insbesondere mit entsprechenden Carbonsäurechloriden, Carbonsäureanhydriden, Carbonsäure-cyaniden, Carbonsäure-methylestern oder -ethylestern - gegebenenfalls in Gegenwart von Reaktionshilfsmitteln, wie z.B. Triethylamin (und gegebenenfalls zusätzlich Zinkchlorid), und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Methylenchlorid:



(Y z.B. CN, Cl)

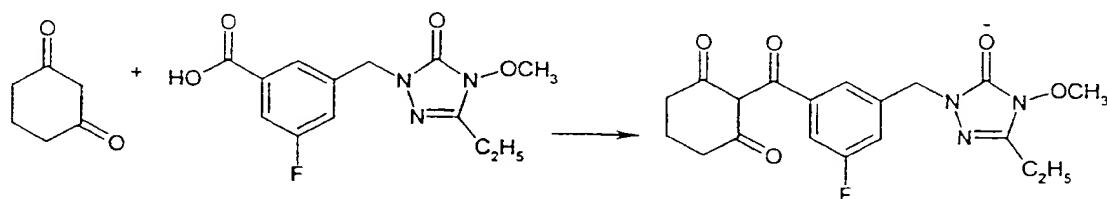
Bei den oben skizzierten Umsetzungen zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) kommt es im allgemeinen neben der erwünschten C-Benzoylierung am Cyclohexandion auch zu einer O-Benzoylierung - vgl. nachstehendes Formelschema (vgl. Synthesis 1978, 925-927; Tetrahedron Lett. 37 (1996), 1007-

1009, WO-A-91/05469). Die hierbei gebildeten O-Benzoyl-Verbindungen werden jedoch unter den Reaktionsbedingungen des erfindungsgemäßen Verfahrens zu den entsprechenden C-Benzoyl-Verbindungen der Formel (I) isomerisiert.



Verwendet man beispielsweise 1,3-Cyclohexandion und 2-(3-Carboxy-5-fluor-benzyl)-5-ethyl-4-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:

10



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Cyclohexandione sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben m, R¹ und R² vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für m, R¹ und R² angegeben wurden.

15

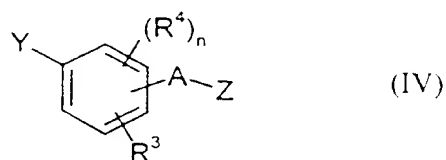
Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden.

- 5 Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Benzoesäuren sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben n, A, R³, R⁴ und Z vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt, ganz besonders bevorzugt oder am meisten bevorzugt für n, A, R³, R⁴ und Z angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (III) sind mit Ausnahme von 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4-difluormethyl-5-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on - alias 2,4-Dichlor-5-(4-difluormethyl-4,5-dihydro-3-methyl-5-oxo-1H-1,2,4-triazol-1-yl)-benzoesäure (CAS-Reg.-Nr. 90208-77-8) und 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4,5-dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on - alias 2,4-Dichlor-5-(4,5-dihydro-3,4-dimethyl-5-oxo-1H-1,2,4-triazol-1-yl)-benzoesäure (CAS-Reg.-Nr. 90208-76-7) - noch nicht aus der Literatur bekannt. Sie sind unter Ausnahme von 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4-difluormethyl-5-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on und 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4,5-dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on (vgl. JP-A-58225070 - zitiert in Chem. Abstracts 100:209881, JP-A-02015069 - zitiert in Chem. Abstracts 113:23929) als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

25

Man erhält die neuen substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III), wenn man Benzoesäurederivate der allgemeinen Formel (IV),



in welcher

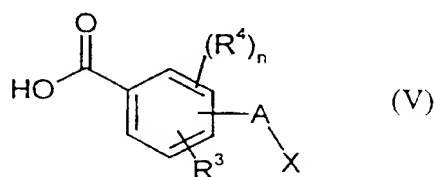
n, A, R³ und R⁴ und Z die oben angegebene Bedeutung haben, und

Y für Cyano, Carbamoyl, Halogencarbonyl oder Alkoxycarbonyl steht,

mit Wasser, gegebenenfalls in Gegenwart eines Hydrolysehilfsmittels, wie z.B. Schwefelsäure, bei Temperaturen zwischen 50°C und 120°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die als Vorprodukte benötigten Benzoesäurederivate der allgemeinen Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. DE-A-3839480, DE-A-4239296, EP-A-597360, EP-A-609734, DE-A-4303676, EP-A-617026, DE-A-4405614, US-A-5378681).

Man erhält die neuen substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III) auch, wenn man Halogen(alkyl)benzoesäuren der allgemeinen Formel (V),



in welcher

n, A, R³ und R⁴ die oben angegebene Bedeutung haben und

X für Halogen (insbesondere Fluor, Chlor oder Brom) steht.

mit Verbindungen der allgemeinen Formel (VI),



5 in welcher

Z die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittel, wie z.B. Triethylamin oder
10 Kaliumcarbonat, und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie
z.B. Aceton, Acetonitril, N,N-Dimethyl-formamid oder N,N-Dimethyl-acetamid, bei
Temperaturen zwischen 50°C und 200°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

15 An Stelle der Halogen(alkyl)benzoesäuren der allgemeinen Formel (V) können
analog zur oben beschriebenen Methodik auch entsprechende Nitrile, Amide und
Ester - insbesondere die Methylester oder die Ethylester - mit Verbindungen der all-
gemeinen Formel (VI) umgesetzt werden. Durch anschließende Hydrolyse nach
üblichen Methoden, beispielsweise durch Umsetzung mit wässrig-ethanolischer
Kalilauge, können dann die entsprechenden substituierten Benzoesäuren erhalten
20 werden.

Die als Vorprodukte benötigten Halogen(alkyl)benzoesäuren der Formel (V) - bzw.
entsprechende Nitrile oder Ester - sind bekannt und/oder können nach an sich be-
kannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A-90369, EP-A-93488, EP-A-
25 399732, EP-A-480641, EP-A-609798, EP-A-763524, DE-A-2126720, WO-A-
93/03722, WO-A-97/38977, US-A-3978127, US-A-4837333).

Die weiter als Vorprodukte benötigten Verbindungen der allgemeinen Formel (VI)
sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden.

30

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der neuen substituierten Benzoyl-cyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird unter Verwendung eines Dehydratisierungsmittels durchgeführt. Es kommen hierbei die üblichen zur Bindung von Wasser geeigneten Chemikalien in Betracht.

5

Als Beispiele hierfür seien Dicyclohexylcarbodiimid und Carbonyl-bis-imidazol genannt.

10

Als besonders gut geeignetes Dehydratisierungsmittel sei Dicyclohexylcarbodiimid genannt.

15

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der neuen substituierten Benzoyl-cyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt.

Als Beispiele hierfür seien Natriumcyanid, Kaliumcyanid, Acetoncyanhydrin, 2-Cyano-2-(trimethylsilyloxy)-propan und Trimethylsilylcyanid genannt.

20

Als besonders gut geeignetes weiteres Reaktionshilfsmittel sei Trimethylsilylcyanid genannt.

25

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der neuen substituierten Benzoyl-cyclohexandione der allgemeinen Formel (I) wird gegebenenfalls unter Verwendung eines weiteren Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als weitere Reaktionshilfsmittel für das erfindungsgemäße Verfahren kommen im allgemeinen basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethyl-amino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-

30

Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU) in Betracht.

5 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetra-
10 chlormethan oder 1,2-Dichlor-ethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethyl-
15 sulfoxid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und
20 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäße Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzu-
25 führen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Um-
30 setzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im all-

gemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianten, Desiccants, Krautabtötmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria,
15 Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

20 Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

25 Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

5 Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

10 Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

15 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich insbesondere zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen Kulturen sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

20 Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

25 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie
5 Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

10 Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate
15 kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum-erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emul-
20 gatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweiß-hydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

25 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospho-lipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid. Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

5

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

15

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxymid(-sodium), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodium), Bromo-

20

butide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cini-

25

don(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxy-

30

dim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflu-

butyl), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl),
Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoro-
glycofen(-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpysulfuron(-methyl, -sodium),
Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Flu-
thiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-
isopropylammonium), Halosafen, Haloxypyr(-ethoxyethyl), Haloxypyr(-P-methyl),
Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic,
Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron, Ioxynil, Iso-
propalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop,
Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron,
Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metola-
chlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Mono-
linuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orben-
carb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen,
Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos,
Pretilachlor, Primisulfuron(-methyl), Procarbazone, Prometryn, Propachlor, Propanil,
Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen-
(ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributi-
carb, Pyridate, Pyriminobac(-methyl), Pyriothiobac(-sodium), Quinchlorac, Quin-
merac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron,
Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-me-
thyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutyl-
azine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulf-
uron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tri-
benuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

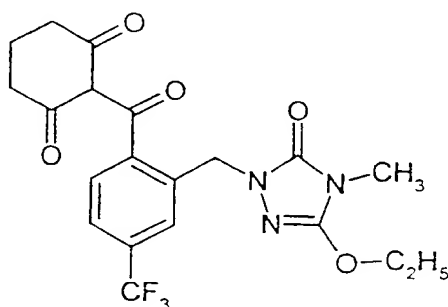
Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insekti-
ziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen
und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:Beispiel 1

1,2 g (3,48 mMol) 5-Ethoxy-4-methyl-2-(2-carboxy-5-trifluormethyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 30 ml Acetonitril suspendiert und mit 0,39 g (3,48 mMol) 1,3-Cyclohexandion und 0,76 g (3,7 mMol) Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) bei Raumtemperatur (ca. 20°C) versetzt. Das Reaktionsgemisch wird über Nacht (ca. 15 Stunden) bei Raumtemperatur gerührt und dann mit 1,0 ml (7,0 mMol) Triethylamin und 0,10 ml (1,39 mMol) Trimethylsilylcyanid versetzt. Nach 3 Stunden bei Raumtemperatur wird mit 100 ml 5%iger wäßriger Natriumcarbonatlösung verrührt, der sich abscheidende Dicyclohexylharnstoff abgesaugt und die alkalische wäßrige Phase mehrfach mit Ethylacetat extrahiert. Dann wird die wäßrige Phase mit 35%iger Salzsäure auf pH 2 eingestellt und mehrfach mit Methylenchlorid extrahiert. Die Methylenchloridphasen werden über Natriumsulfat getrocknet und eingeeengt.

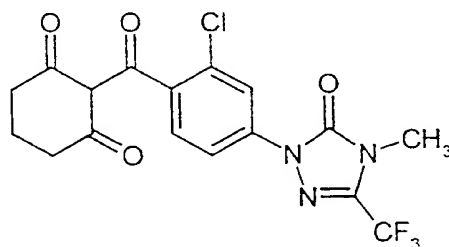
Man erhält 0.8 g (52 % der Theorie) 5-Ethoxy-4-methyl-2-[2-(2.6-dioxo-cyclohexyl-carbonyl)-5-trifluormethyl-benzyl]-2,4-dihydro-3H-1.2.4-triazol-3-on als amorphen Rückstand.

5

logP (bei pH=2 bestimmt): 2,70.

10

Beispiel 2



15

Zu einer Suspension aus 2,15 g (6,5 mMol) 2-(4-Carboxy-3-chlor-phenyl)-4-methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1.2.4-triazol-3-on, 0,83 g (7,2 mMol) 1.3-Cyclohexandion und 40 ml Acetonitril wird eine Lösung von 1,5 g (7,2 mMol) Dicyclohexylcarbodiimid in 40 ml Acetonitril gegeben und die Reaktionsmischung wird 16 Stunden bei 20°C gerührt. Dann werden 1,3 g (13 mMol) Triethylamin und 0,26 g (2,6 mMol) Trimethylsilylcyanid dazu gegeben und das Reaktionsgemisch wird weitere 4 Stunden bei 20°C gerührt. Dann wird mit 180 ml 2%iger wässriger Sodalösung verrührt und abgesaugt. Die Mutterlauge wird mit Essigsäureethylester extrahiert.

25 Dann wird die wässrige Phase mit 2N-Salzsäure angesäuert und mit Methylenchlorid extrahiert. Die organische Phase wird getrocknet, im Wasserstrahlvakuum eingeeengt

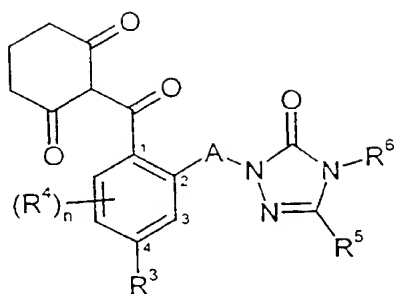
und mit Diethylether/Petrolether digeriert. Das kristallin angefallene Produkt wird durch Absaugen isoliert.

5

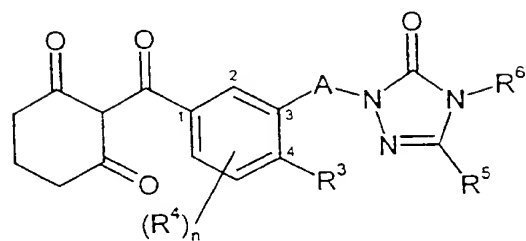
Man erhält 1,6 g (59% der Theorie) 2-[4-(2,6-Dioxocyclohexylcarbonyl)-3-chlorphenyl]-4-methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 182°C.

10 logP (bei pH=2 bestimmt): 3,13.

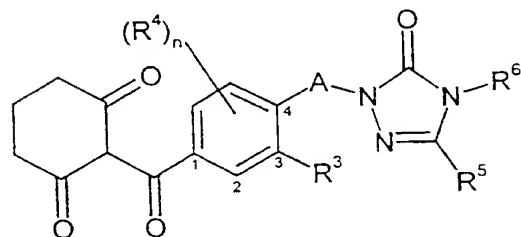
15 Analog zu den Herstellungsbeispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in den nachstehenden Tabellen 1 und 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) - bzw. der Formeln (IA-3), (IB-2), (IC-2) oder (ID) - hergestellt werden.



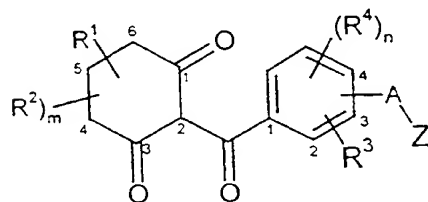
(IA-3)



(IB-2)













(IC-2)





(ID)








Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formeln (IA-3), (IB-2), (IC-2)




Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
3	-	H	H	CF ₃	CH ₃	(IC-2) logP = 2,41 ^a)
4	CH ₂	CF ₃	H			(IA-3) logP = 2,41 ^a)
5	CH ₂	SO ₂ CH ₃	H			(IB-2) Fp.: 153°C
6	CH ₂	SO ₂ CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	(IA-3) Fp.: 162°C
7	CH ₂	Cl	H	CH ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 1,50 ^a)
8	CH ₂	Cl	H	CF ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 2,44 ^a)
9	CH ₂	Cl	H			(IB-2) logP = 2,23 ^b)
10	CH ₂	Br	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IA-3) logP = 2,68 ^a)
11	CH ₂	F	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 1,73 ^a)
12	CH ₂	F	H	SCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,99 ^a)
13	CH ₂	F	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,83 ^a)



Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
14	CH ₂	Br	H	CH ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 1,57a)
15	CH ₂	Br	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB-2) Fp.: 132°C
16	CH ₂	Br	H			(IB-2) logP = 2,31a)
17	CH ₂	Cl	H	OC ₂ H ₅		(IA-3) logP = 3,03a)
18	CH ₂	Cl	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,75a)
19	CH ₂	Cl	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IA-3) logP = 2,60a)
20	CH ₂	NO ₂	H	SCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,04a)
21	CH ₂	CF ₃	H	OC ₂ H ₅		(IA-3) logP = 3,02a)
22	CH ₂	CF ₃	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IA-3) logP = 2,91a)
23	CH ₂	CF ₃	H	SCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,59a)
24	CH ₂	OCH ₃	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 1,99a)
25	CH ₂	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IA-3) logP = 2,18a)



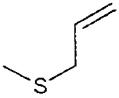

Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
26	CH ₂	Br	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 2,46a)
27	CH ₂	Br	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,85a)
28	CH ₂	H	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,33a)
29	CH ₂	CF ₃	H	OCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,35a)
30	CH ₂	F	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,47a)
31	CH ₂	F	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IA-3) logP = 2,28a)
32	CH ₂	F	H	OCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,76a)
33	CH ₂	H	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 1,93a)
34	CH ₂	H	H	OCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,61a)

Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
35	-	H	(2) CF ₃	CF ₃	CH ₃	(IC-2) Fp.: 190°C
36	-	H	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,48 ^{a)}
37	-	Cl	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,83 ^{a)}
38	-	H	(2) Cl	CH ₃	CH ₃	(IC-2) Fp.: 196°C
39	CH ₂	Cl	(2) Cl	CF ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 2,79 ^{a)}
40	-	Br	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,90 ^{a)}
41	CH ₂	Cl	(2) Cl	SCH ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 2,38 ^{a)}
42	CH ₂	Cl	(2) Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IB-2) logP = 2,48 ^{a)}
43	CH ₂	Cl	(2) Cl			(IB-2) logP = 2,62 ^{a)}
44	CH ₂	Cl	(2) Cl	OCH ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 2,14 ^{a)}
45	CH ₂	Cl	(2) Cl	OC ₃ H ₇ -i	CH ₃	(IB-2) logP = 2,79 ^{a)}
46	CH ₂	Cl	(2) Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 2,84 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
47	CH ₂	Cl	(2) Cl	Br	CH ₃	(IB-2) logP = 2,26 ^{a)}
48	CH ₂	Cl	(2) Cl	H	CH ₃	(IB-2) logP = 1,69 ^{a)}
49	CH ₂	Cl	(2) Cl		CH ₃	(IB-2) logP = 2,25 ^{a)}
50	CH ₂	Cl	(2) Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	(IB-2) logP = 2,18 ^{a)}
51	CH ₂	Cl	(2) Cl	CH ₃	CH ₃	(IB-2) logP = 1,79 ^{a)}
52	CH ₂	Cl	(2) Cl	R ⁵ + R ⁶ :	(CH ₂) ₄	(IB-2) logP = 1,98 ^{a)}
53	CH ₂	Cl	(2) Cl	OCH ₃		(IB-2) logP = 2,45 ^{a)}
54	CH ₂	Cl	(2) Cl	OC ₂ H ₅		(IB-2) logP = 2,79 ^{a)}
55	CH ₂	Cl	(2) Cl	OC ₃ H _{7-i}		(IB-2) logP = 3,14 ^{a)}
56	CH ₂	Cl	(2) Cl	OCH ₂ CF ₃		(IB-2) logP = 3,18 ^{a)}
57	CH ₂	Cl	(2) Cl	SCH ₃		(IB-2) logP = 2,77 ^{a)}
58	CH ₂	Cl	(2) Cl	N(CH ₃) ₂		(IB-2) logP = 2,49 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
59	CH ₂	Cl	(2) Cl	CH ₃		(IB-2) logP = 2,09 ^{a)}
60	CH ₂	Cl	(2) Cl	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IB-2) logP = 2,65 ^{a)}
61	CH ₂	CF ₃	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 3,06 ^{a)}
62	CH ₂	H	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	(IA-3) logP = 2,10 ^{a)}
63	CH ₂	H	H	SCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,85 ^{a)}
64	CH ₂	H	H			(IA-3) logP = 2,09 ^{a)}
65	CH ₂	Cl	(5) Cl	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 3,24 ^{a)}
66	CH ₂	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,71 ^{a)}
67	CH ₂	SO ₂ CH ₃	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 1,64 ^{a)}
68	CH ₂	Br	H	R ⁵ + R ⁶ :	(CH ₂) ₄	(IA-3) logP = 1,64 ^{a)}
69	CH ₂	Br	H	OC ₃ H _{7-n}	CH ₃	(IA-3) logP = 2,82 ^{a)}
70	CH ₂	Br	H	OC ₃ H _{7-i}	CH ₃	(IA-3) logP = 2,84 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
71	CH ₂	CF ₃	H	OC ₃ H ₇ -i	CH ₃	(IA-3) logP = 3,05 ^{a)}
72	CH ₂	CF ₃	H	OC ₃ H ₇ -n	CH ₃	(IA-3) logP = 3,06 ^{a)}
73	CH ₂	Br	H	Br	CH ₃	(IA-3) logP = 2,33 ^{a)}
74	CH ₂	CF ₃	H	OC ₃ H ₇ -i		(IA-3) logP = 3,38 ^{a)}
75	CH ₂	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃		(IA-3) logP = 2,53 ^{a)}
76	CH ₂	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,26 ^{a)}
77	CH ₂	I	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,98 ^{a)}
78	CH ₂	Br	H	SCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,36 ^{a)}
79	CH ₂	Cl	H	SCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,30 ^{a)}
80	CH ₂	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,06 ^{a)}
81	CH ₂	CF ₃	H	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	(IA-3) logP = 3,01 ^{a)}
82	CH ₂	CF ₃	H	N(CH ₃) ₂	CH ₃	(IA-3) logP = 2,40 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
83	CH ₂	CF ₃	H	Br	CH ₃	(IA-3) logP = 2,54 ^{a)}
84	CH ₂	H	(3) CH ₃	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 2,21 ^{a)}
85	CH ₂	Br	H			(IA-3) logP = 2,62 ^{a)}
86	CH ₂	Br	H		CH ₃	(IA-3) logP = 2,99 ^{a)}
87	CH ₂	CF ₃	H	SC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 2,94 ^{a)}
88	CH ₂	CF ₃	H	SC ₃ H _{7-i}	CH ₃	(IA-3) logP = 2,63 ^{a)}
89	CH ₂	CF ₃	H	R ⁵ + R ⁶ :	(CH ₂) ₄	(IA-3) logP = 2,25 ^{a)}
90	CH ₂	CF ₃	H	OCH ₃		(IA-3) logP = 2,65 ^{a)}
91	CH ₂	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 3,06 ^{a)}
92	CH ₂	CN	H	CF ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 2,29 ^{a)}
93	CH ₂	F	H	N(CH ₃) ₂	CH ₃	(IA-3) logP = 1,81 ^{a)}
94	CH ₂	F	H	OC ₃ H _{7-n}	CH ₃	(IA-3) logP = 2,44 ^{a)}



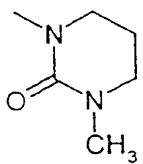
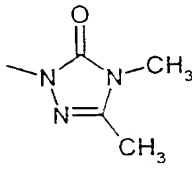
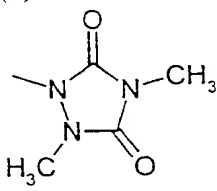
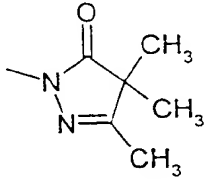
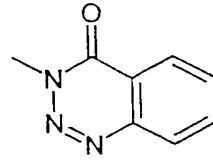
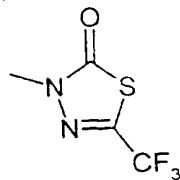
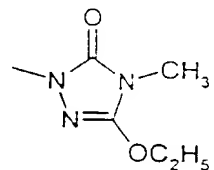
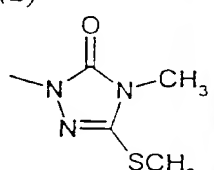
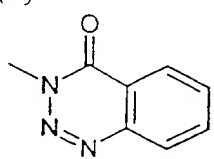
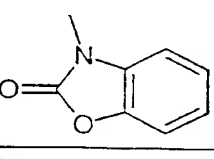
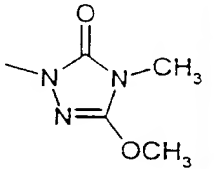
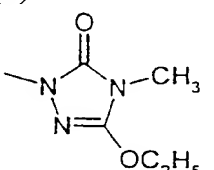
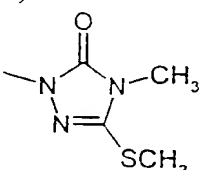
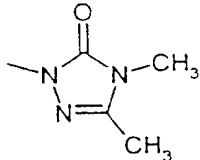
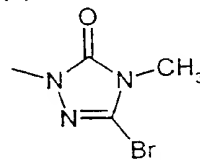
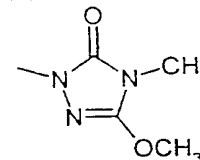
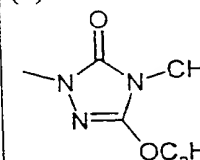
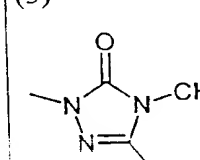
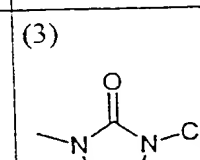
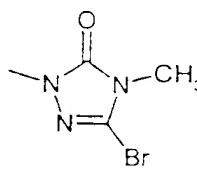
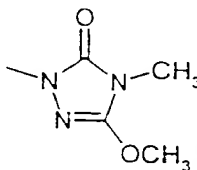
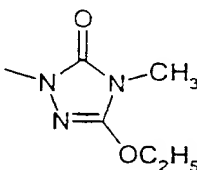
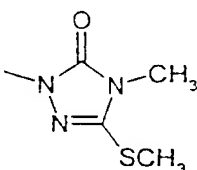
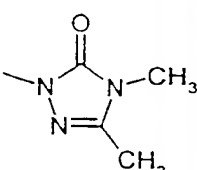
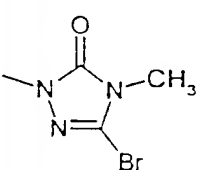
Bsp.- Nr.	A	R ³	(Position) (R ⁴) _n	R ⁵	R ⁶	(Formel) Physikal. Daten
95	CH ₂	F	H	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	(IA-3) logP = 1,69 ^{a)}
96	CH ₂	F	H	OCH ₃		(IA-3) logP = 2,05 ^{a)}
97	CH ₂	F	H	OC ₂ H ₅		(IA-3) logP = 2,39 ^{a)}
98	CH ₂	I	H	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IA-3) logP = 2,59 ^{a)}
99	CH ₂	OCH ₃	(2) NO ₂	OC ₂ H ₅	CH ₃	(IC-2) logP = 2,24 ^{a)}
100	CH ₂	OCH ₃	(2) NO ₂	SCH ₃	CH ₃	(IC-2) logP = 2,18 ^{a)}

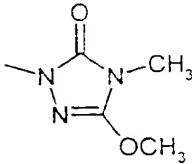
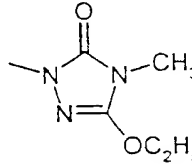
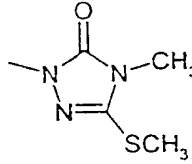
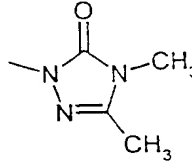
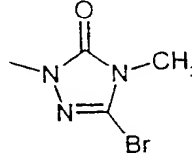
Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (ID)

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ¹	(Posi- tion) (R ²) _m	(Posi- tion) R ³	(Posi- tion) (R ⁴) _n	(Position) Z	Physikal. Daten
ID-1	CH ₂	H	H	(2) Cl	(4) Cl	 (3)	logP = 4,26 ^{a)}
ID-2	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(4) CF ₃	H	 (2)	logP = 2,61 ^{a)}
ID-3	CH ₂	H	H	(4) CF ₃	H	 (2)	logP = 2,24 ^{a)}
ID-4	CH ₂	H	H	(4) CF ₃	H	 (2)	logP = 2,63 ^{a)} -
ID-5	CH ₂	H	H	H	H	 (2)	logP = 2,35 ^{a)}
ID-6	CH ₂	H	H	(4) CF ₃	H	 (2)	logP = 3,77 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ¹	(Position) (R ²) _m	(Position) R ³	(Position) (R ⁴) _n	(Position) Z	Physikal. Daten
ID-7	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(4) CF ₃	H	(2) 	logP = 3,27 ^{a)}
ID-8	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(4) CF ₃	H	(2) 	logP = 3,18 ^{a)}
ID-9	CH ₂	H	H	(4) Br	H	(2) 	logP = 2,92 ^{a)}
ID-10	CH ₂	H	H	(4) Br	H	(2) 	logP = 3,04 ^{a)}
ID-11	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	Fp.: 140°C - logP = 2,72 ^{a)}
ID-12	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	Fp.: 103°C logP = 3,08 ^{a)}
ID-13	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	Fp.: 118°C logP = 2,98 ^{a)}

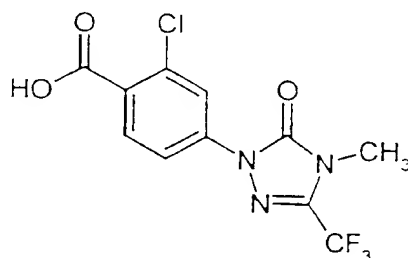
Bsp.- Nr.	A	(Position) R ¹	(Position) (R ²) _m	(Position) R ³	(Position) (R ⁴) _n	(Position) Z	Physikal. Daten
ID-14	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	Fp.: 132°C logP = 2,32 ^{a)}
ID-15	CH ₂	(5) CH ₃	(5) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	Fp.: 170°C logP = 2,86 ^{a)}
ID-16	CH ₂	(4) CH ₃	(4) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,78 ^{a)}
ID-17	CH ₂	(4) CH ₃	(4) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 3,15 ^{a)}
ID-18	CH ₂	(4) CH ₃	(4) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 3,06 ^{a)}
ID-19	CH ₂	(4) CH ₃	(4) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,38 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ¹	(Position) (R ²) _m	(Position) R ³	(Position) (R ⁴) _n	(Position) Z	Physikal. Daten
ID-20	CH ₂	(4) CH ₃	(4) CH ₃	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,94 ^{a)}
ID-21	CH ₂	(5) C ₃ H ₇ -i	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 3,12 ^{a)}
ID-22	CH ₂	(5) C ₃ H ₇ -i	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 3,49 ^{a)}
ID-23	CH ₂	(5) C ₃ H ₇ -i	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 3,39 ^{a)}
ID-24	CH ₂	(5) C ₃ H ₇ -i	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 2,70 ^{a)}
ID-25	CH ₂	(5) C ₃ H ₇ -i	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	logP = 3,28 ^{a)}

Bsp.- Nr.	A	(Position) R ¹	(Position) (R ²) _m	(Position) R ³	(Position) (R ⁴) _n	(Position) Z	Physikal. Daten
ID-26	CH ₂	(5) CH ₃	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	
ID-27	CH ₂	(5) CH ₃	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	
ID-28	CH ₂	(5) CH ₃	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	
ID-29	CH ₂	(5) CH ₃	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	-
ID-30	CH ₂	(5) CH ₃	H	(2) Cl	(4) Cl	(3) 	

Ausgangsstoffe der Formel (III):

Beispiel (III-1)



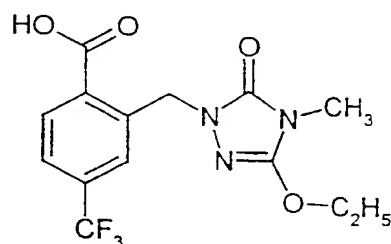
5

4,5 g (15 mMol) 2-(3-Chlor-4-cyano-phenyl)-4-methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 80 ml 60%iger Schwefelsäure aufgenommen und die Mischung wird 6 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wird das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

10

Man erhält 4,5 g (91% der Theorie) 2-(3-Carboxy-4-chlor-phenyl)-4-methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 223°C.

Beispiel (III-2)



15

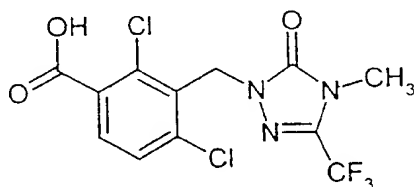
2 g (4,9 mMol) 5-Brom-4-methyl-2-(2-ethoxycarbonyl-5-trifluormethyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on (vgl. Beispiel IV-1) werden in 30 ml 10%iger ethanolischer Kalilauge gelöst und 2 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt, in 20 ml Wasser aufgenommen und mit verdünnter Salzsäure angesäuert. Der ausfallende Feststoff wird filtriert und getrocknet.

20

Man erhält 1,2 g (71% der Theorie) 5-Ethoxy-4-methyl-2-(2-carboxy-5-trifluor-methyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als festes Produkt.

logP: 2,18^a)

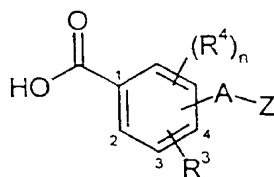
5 Beispiel (III-3)



13,4 g (35 mMol) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-methoxycarbonyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 60 ml 1,4-Dioxan vorgelegt und
 10 eine Lösung von 1,54 g (38,5 mMol) Natriumhydroxid in 20 ml Wasser wird bei Raumtemperatur langsam eindosiert. Die Reaktionsmischung wird 150 Minuten bei 60°C gerührt und anschließend im Wasserstrahlvakuum eingengt. Der Rückstand wird in 100 ml Wasser gelöst und durch Zugabe von konz. Salzsäure wird der pH-Wert der Lösung auf 1 eingestellt. Das hierbei kristallin angefallene Produkt wird
 15 durch Absaugen isoliert.

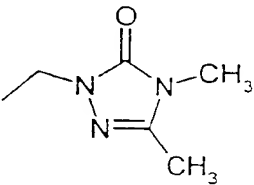
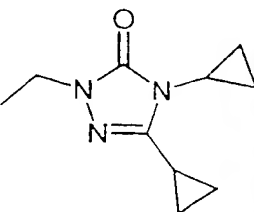
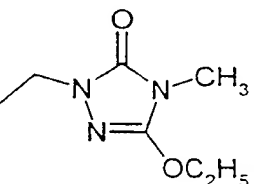
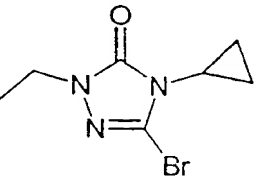
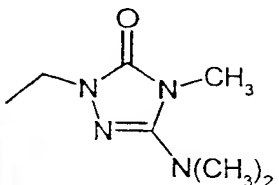
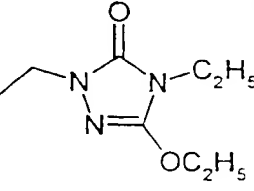
Man erhält 11,7 g (90% der Theorie) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-carboxy-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 207°C.

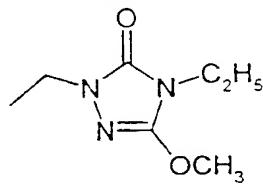
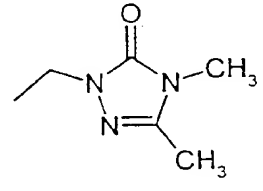
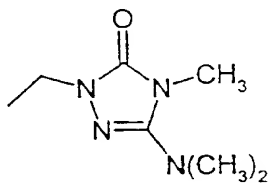
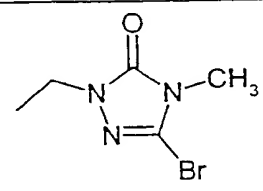
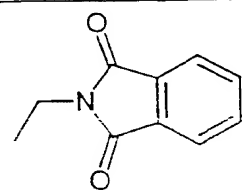
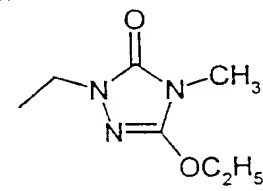
20 Analog zu den Beispielen (III-1) bis (III-3) können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (III) hergestellt werden.

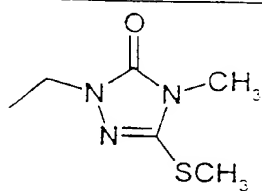
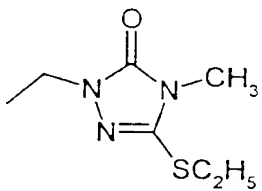
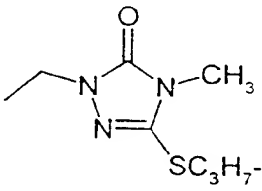
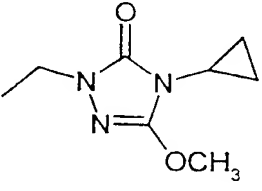
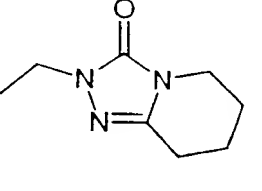
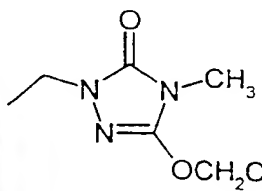


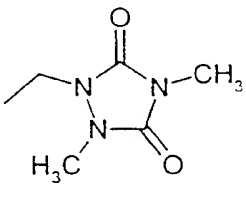
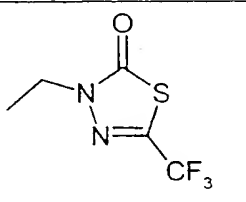
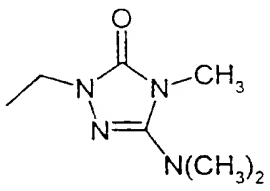
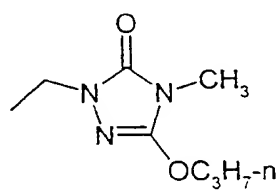
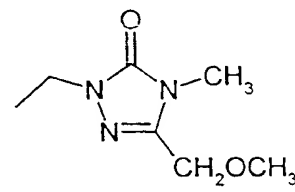
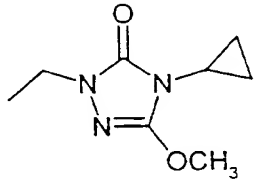
(III)

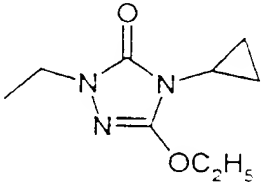
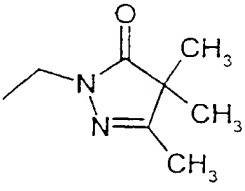
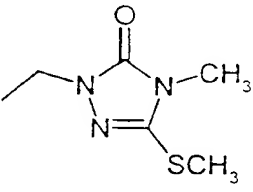
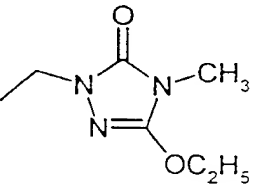
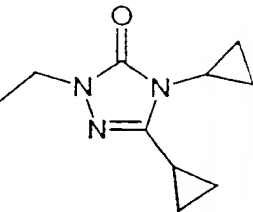
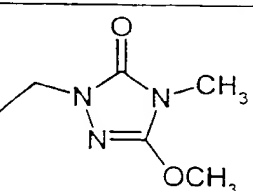
Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (III)

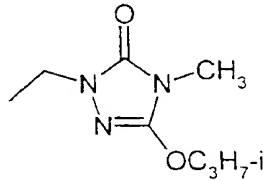
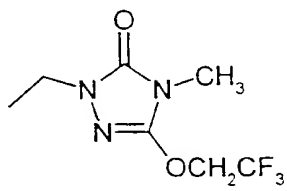
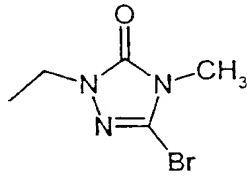
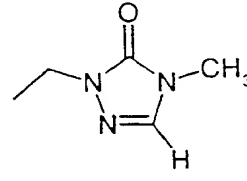
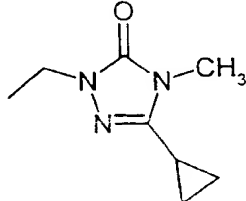
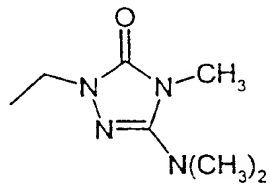
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-4	(4-) Cl	H	 (2-)	logP = 1,39 ^{a)}
III-5	(4-) SO ₂ CH ₃	H	 (3-)	logP = 1,47 ^{a)}
III-6	(4-) F	H	 (2-)	logP = 1,73 ^{a)}
III-7	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1,65 ^{a)}
III-8	(4-) Br	H	 (2-)	logP = 1,74 ^{a)}
III-9	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2,43 ^{a)}

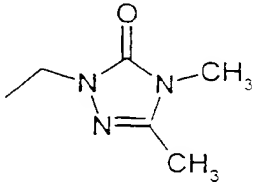
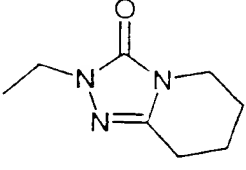
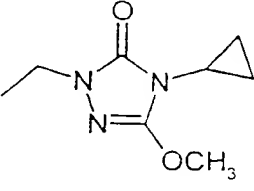
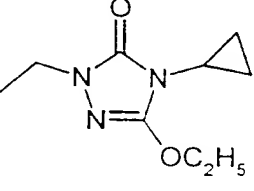
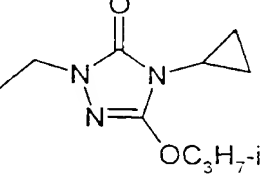
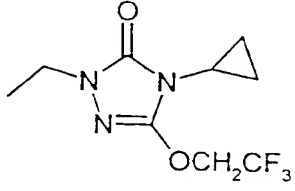
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-10	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2,12 ^{a)}
III-11	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1,61 ^{a)}
III-12	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1,93 ^{a)}
III-13	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2,01 ^{a)}
III-14	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1,77 ^{a)}
III-15	(3-) CH ₃	H	 (2-)	logP = 1,70 ^{a)}

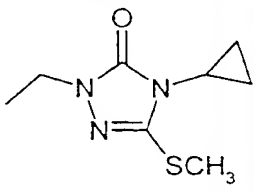
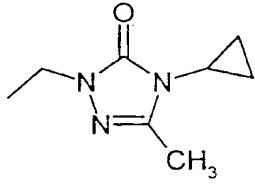
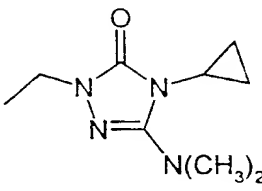
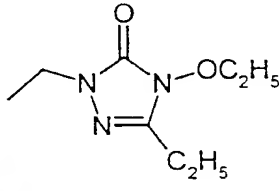
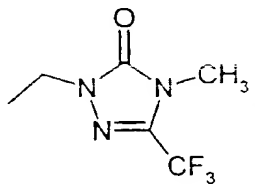
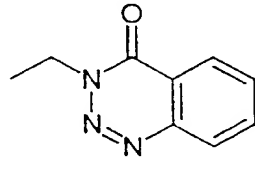
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-16	(4-) SO ₂ CH ₃	H	 (2-)	logP = 1.07 ^{a)}
III-17	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2.35 ^{a)}
III-18	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2.63 ^{a)}
III-19	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2.13 ^{a)}
III-20	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1.82 ^{a)}
III-21	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2.48 ^{a)}

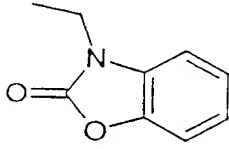
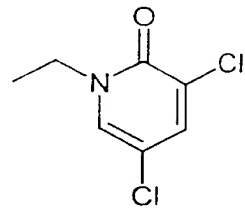
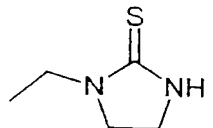
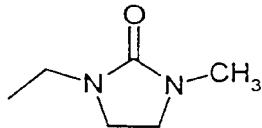
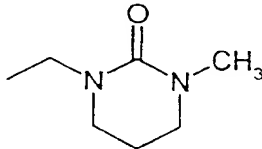
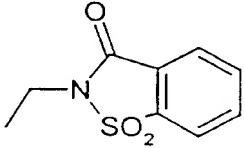
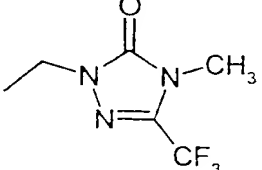
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-22	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1,73 ^{a)}
III-23	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 3,11 ^{a)}
III-24	(4-) F	H	 (2-)	logP = 1,43 ^{a)}
III-25	(4-) F	H	 (2-)	logP = 1,97 ^{a)}
III-26	(4-) F	H	 (2-)	logP = 1,30 ^{a)}
III-27	(4-) F	H	 (2-)	logP = 1,63 ^{a)}

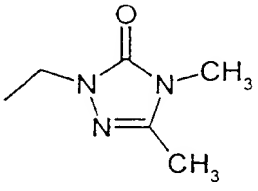
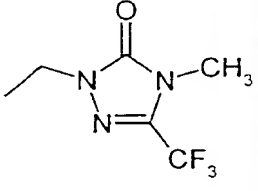
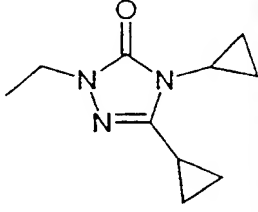
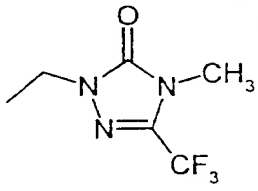
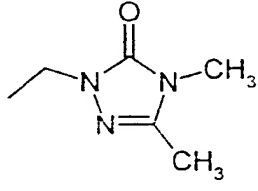
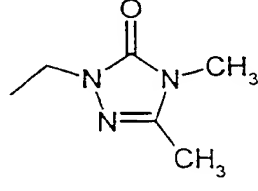
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-28	(4-) F	H	 (2-)	logP = 1,93 ^{a)}
III-29	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 1,78 ^{a)}
III-30	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 230°C logP = 1,63 ^{a)}
III-31	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 190°C logP = 1,73 ^{a)}
III-32	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 210°C logP = 1,87 ^{a)}
III-33	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 210°C logP = 1,43 ^{a)}

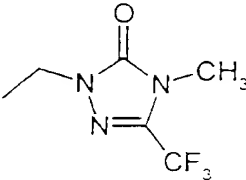
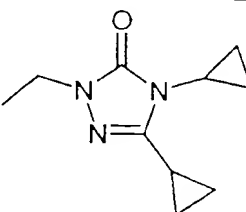
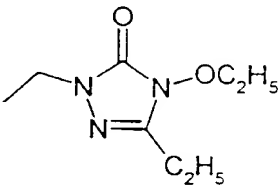
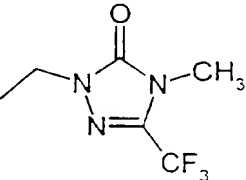
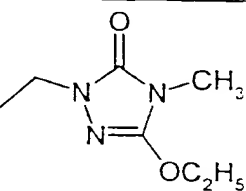
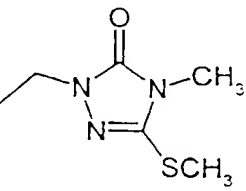
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-34	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 164°C logP = 2,01 ^{a)}
III-35	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 168°C logP = 2,04 ^{a)}
III-36	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 218°C logP = 1,53 ^{a)}
III-37	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 259°C logP = 0,98 ^{a)}
III-38	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 210°C logP = 1,56 ^{a)}
III-39	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 197°C logP = 1,51 ^{a)}

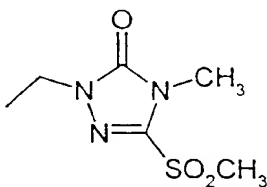
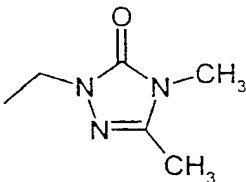
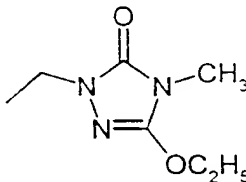
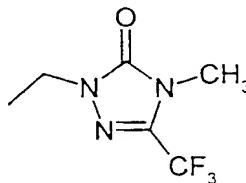
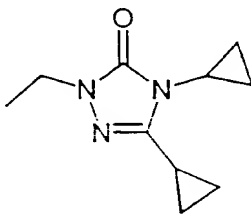
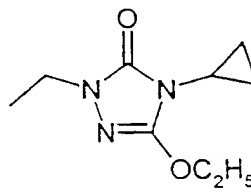
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-40	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 262°C logP = 1,11 ^{a)}
III-41	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 249°C logP = 1,30 ^{a)}
III-42	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 200°C logP = 1,71 ^{a)}
III-43	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 189°C logP = 2,01 ^{a)}
III-44	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 178°C logP = 2,28 ^{a)}
III-45	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 161°C logP = 2,31 ^{a)}

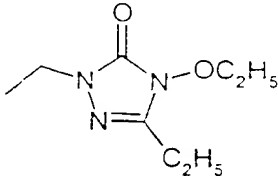
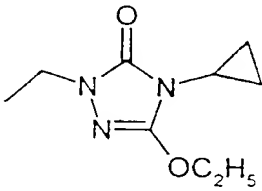
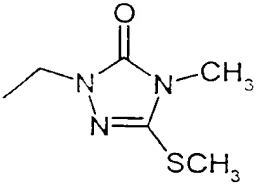
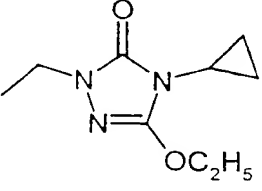
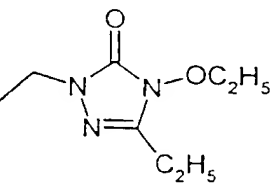
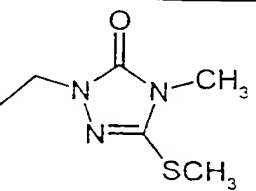
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-46	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 200°C logP = 1,98 ^{a)}
III-47	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 201°C logP = 1,39 ^{a)}
III-48	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 207°C logP = 1,77 ^{a)}
III-49	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	Fp.: 140°C logP = 1,88 ^{a)}
III-50	(4-) OCH ₂ CHF ₂	H	 (2-)	Fp.: 154°C logP = 2,14 ^{a)}
III-51	H	H	 (2-)	Fp.: 214°C logP = 1,87 ^{a)}

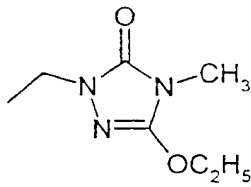
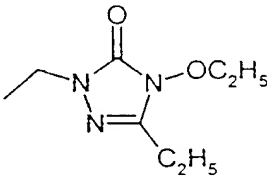
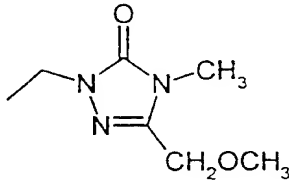
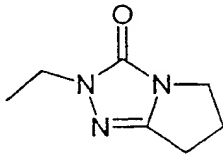
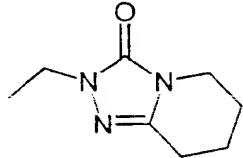
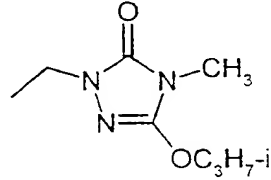
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-52	H	H	 (2-)	Fp.: 194°C logP = 2,07 ^{a)}
III-53	H	H	 (2-)	Fp.: 181°C logP = 1,97 ^{a)}
III-54	H	H	 (2-)	Fp.: 251°C logP = 1,14 ^{a)}
III-55	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	logP = 1,38 ^{a)}
III-56	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	logP = 1,48 ^{a)}
III-57	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	
III-58	(4-) Cl	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,42 ppm.

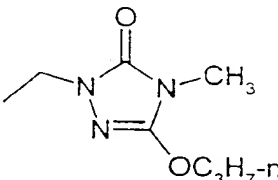
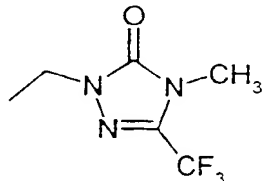
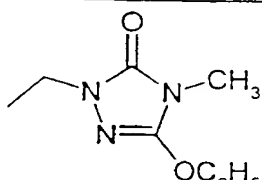
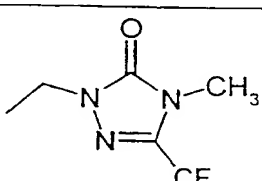
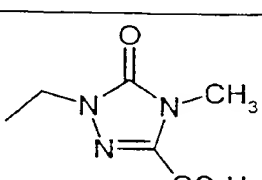
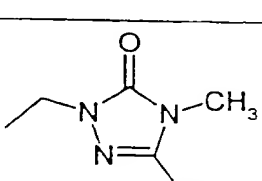
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-59	(4-) CF ₃	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,48 ppm.
III-60	(4-) CF ₃	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,60 ppm. LogP = 2,47 ^{a)}
III-61	(4-) CF ₃	H	 (2-)	logP = 2,33 ^{a)}
III-62	(4-) SO ₂ CH ₃	H	 (3-)	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,14 ppm.
III-63	(4-) SO ₂ CH ₃	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,27 ppm.
III-64	(4-) Cl	H	 (3-)	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,12 ppm.

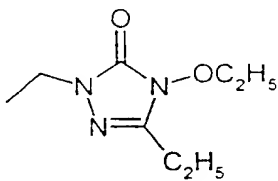
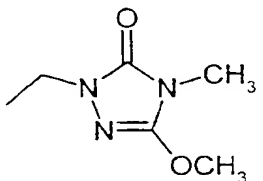
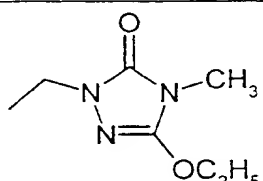
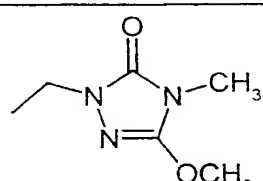
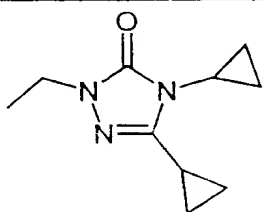
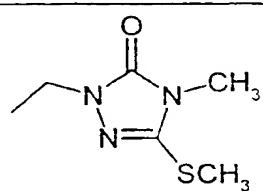
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-65	(4-) Cl	H	 (3-)	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,20 ppm.
III-66	(4-) Cl	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,03 ppm.
III-67	(4-) Br	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,24 ppm.
III-68	(4-) Br	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,39 ppm.
III-69	(4-) F	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,19 ppm.
III-70	(4-) F	H	 (2-)	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,30 ppm.

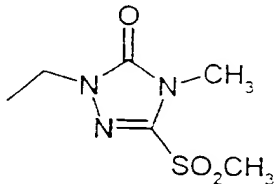
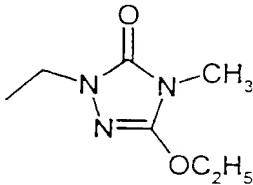
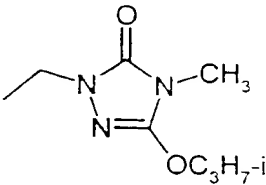
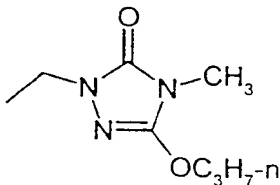
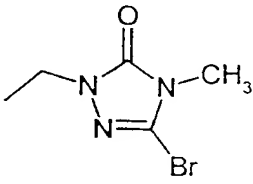
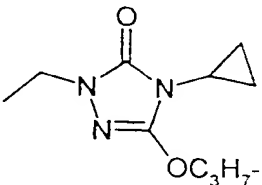
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-71	(4-) F	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,43 ppm.
III-72	(4-) Br	H	(3-) 	¹ H-NMR, (CDCl ₃ , δ): 5,10 ppm.
III-73	(4-) Br	H	(3-) 	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,03 ppm.
III-74	(4-) Br	H	(3-) 	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,19 ppm.
III-75	(4-) Br	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,01 ppm.
III-76	(4-) Cl	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 5,14 ppm.

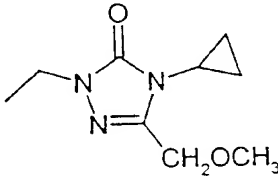
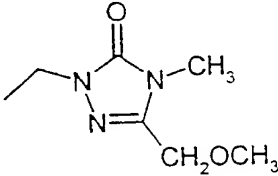
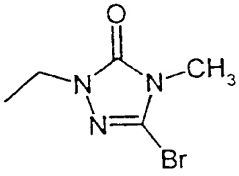
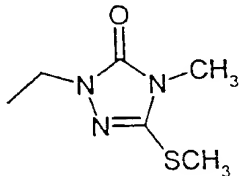
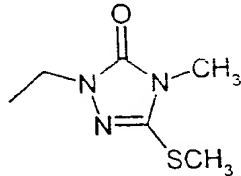
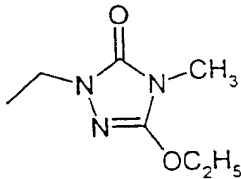
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-77	(4-) Cl	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,25 ppm.
III-78	(4-) NO ₂	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,23 ppm.
III-79	(4-) NO ₂	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,37 ppm.
III-80	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 2,46 ^{a)}
III-81	(4-) CF ₃	H	(2-) 	¹ H-NMR (DMSO-D6, δ): 5,31 ppm.
III-82	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 2,08 ^{a)}

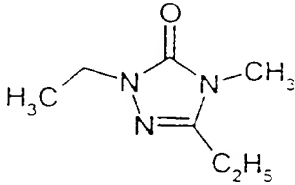
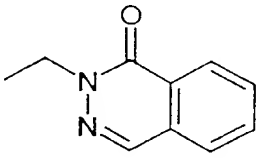
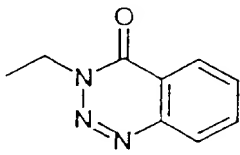
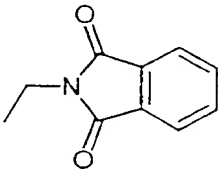
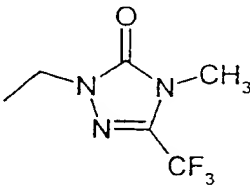
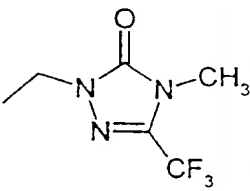
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-83	(4-) OCH ₃	H	 (2-)	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5.38 ppm.
III-84	(4-) OCH ₃	H	 (2-)	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5.43 ppm.
III-85	(4-) CF ₃	H	 (2-)	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5.47 ppm.
III-86	(4-) Br	H	 (2-)	logP = 1.44 ^{a)}
III-87	(4-) Br	H	 (2-)	logP = 1.63 ^{a)}
III-88	(4-) Br	H	 (2-)	logP = 2.27 ^{a)}

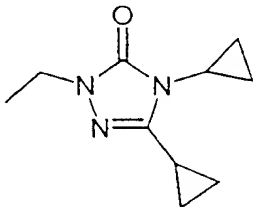
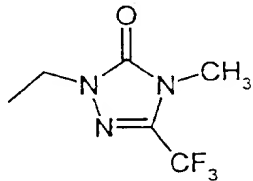
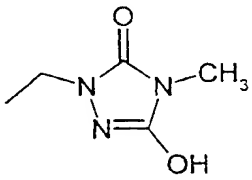
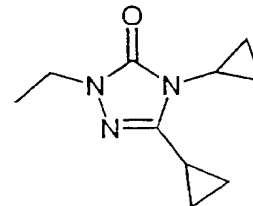
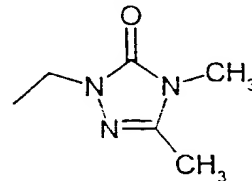
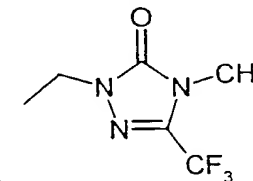
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-89	(4-) Br	H	(2-) 	logP = 2,31 ^{a)}
III-90	H	H	(2-) 	logP = 1,82 ^{a)}
III-91	(4-) Br	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,32 ppm.
III-92	(4-) Br	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,53 ppm.
III-93	(4-) F	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,39 ppm.
III-94	(4-) F	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,57 ppm.

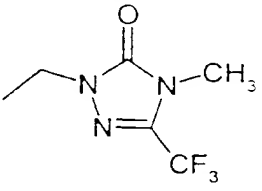
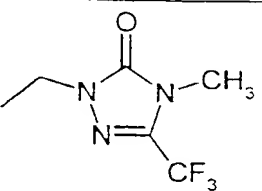
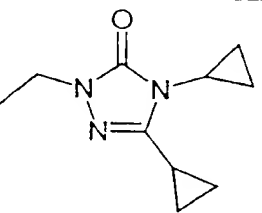
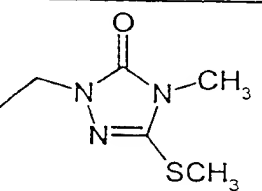
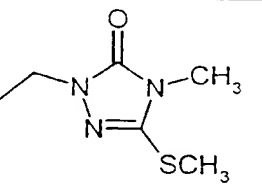
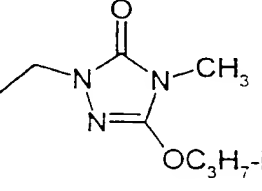
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-95	(4-) F	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,44 ppm.
III-96	(4-) F	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,41 ppm.
III-97	H	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,34 ppm.
III-98	H	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,38 ppm.
III-99	H	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,26 ppm.
III-100	H	H	(2-) 	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,43 ppm.

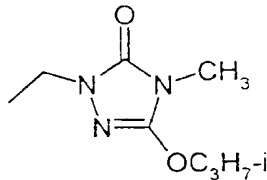
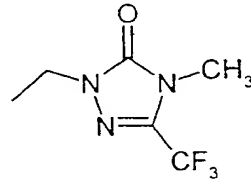
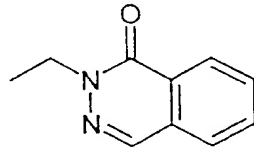
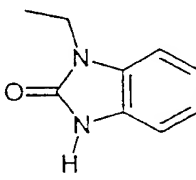
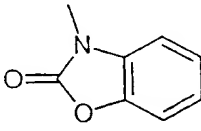
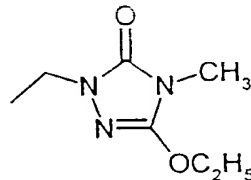
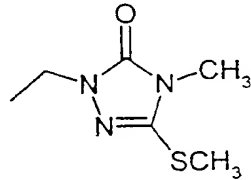
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-101	H	H	(2-) 	logP = 1,23 ^{a)}
III-102	(4-) SO ₂ CH ₃	H	(2-) 	logP = 1,14 ^{a)}
III-103	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 2,45 ^{a)}
III-104	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 2,48 ^{a)}
III-105	(4-) Br	H	(2-) 	logP = 1,85 ^{a)}
III-106	(4-) CF ₃	H	(3-) 	logP = 2,74 ^{a)}

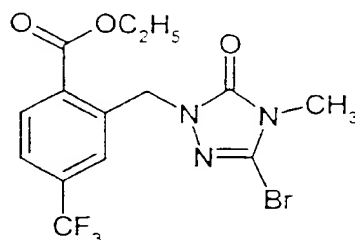
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-107	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 2,01 ^{a)}
III-108	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 1,79 ^{a)}
III-109	(4-) CF ₃	H	(2-) 	logP = 1,65 ^{a)}
III-110	(4-) Br	H	(2-) 	logP = 1,90 ^{a)}
III-111	(4-) Cl	H	(2-) 	logP = 1,83 ^{a)}
III-112	(4-) I	H	(2-) 	logP = 2,06 ^{a)}

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-113	(4-) I	H	(2-) 	
III-114	(4-) Br	H	(2-) 	Fp.: 191°C
III-115	(4-) Br	H	(2-) 	Fp.: 213°C
III-116	H	H	(2-) 	
III-117	H	H	(2-) 	Fp.: 112°C
III-118	(4-) CF ₃	H	(2-) 	Fp.: 158°C

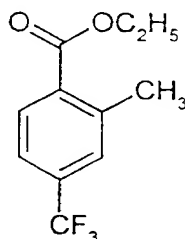
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-119	(4-) CF ₃	H	 (2-)	Fp.: 162°C
III-120	(4-) Cl	(5-) Cl	 (2-)	Fp.: 167°C
III-121	H	H		Fp.: 188°C
III-122	H	H	 (2-)	
III-123	H	H		Fp.: 131°C
III-124	(4-) Cl	H	 (2-)	Fp.: 109°C

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-125	(4-) I	H	 (2-)	Fp.: 104°C
III-126	(4-) Br	H	 (2-)	Fp.: 99°C
III-127	(4-) Br	H	 (2-)	Fp.: 174°C
III-128	H	H	 (2-)	Fp.: 122°C
III-129	(4-) Br	H	 (2-)	Fp.: 164°C
III-130	H	H	 (2-)	Fp.: 154°C

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	Physikal. Daten
III-131	(4-) Br	H	 (2-)	Fp.: 161°C
III-132	(4-) CN	H	 (2-)	Fp.: 196°C
III-133	H	H	 (2-)	Fp.: 192°C
III-134	H	H	 (2-)	
III-135	(4-) Br	H	 (2)	Fp.: 252°C -
III-136	(2-) NO ₂	(3-) OCH ₃	 (4-)	logP = 1,65 ^{a)}
III-137	(2-) NO ₂	(3-) OCH ₃	 (4-)	logP = 1,58 ^{a)}

Ausgangsstoffe der Formel (IV):Beispiel (IV-1)

5

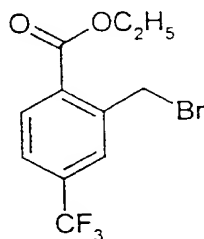
Stufe 1

10

10 g (49 mmol) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure werden in 150 ml Ethanol gelöst und mit 1 ml konz. Schwefelsäure versetzt. Nach 24 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wird die Lösung eingeengt, in Methylenchlorid aufgenommen und mit gesättigter wäßriger Natriumhydrogencarbonat-Lösung extrahiert. Die Methylenchlorid-Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und im Wasserstrahlvakuum eingeengt.

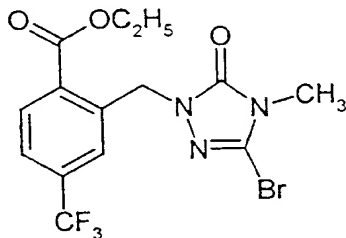
15

Man erhält 9 g (80% der Theorie) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester als amorphen Rückstand.

Stufe 2

9 g (39 mMol) 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester werden in 200 ml Tetrachlormethan gelöst und mit 7 g (39 mMol) *N*-Brom-succinimid und 0,1 g Di-
5 benzoylperoxid versetzt. Nach 6 Stunden Erhitzen unter Rückfluß wird das abge-
schiedene Succinimid abfiltriert und das Filtrat im Wasserstrahlvakuum eingeeengt.

Man erhält 12 g eines amorphen Rückstandes, der neben 2-Brommethyl-4-trifluor-
methyl-benzoesäure-ethylester noch 17% 2,2-Dibrommethyl-4-trifluormethyl-ben-
10 zoesäure-ethylester und 12% 2-Methyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester ent-
hält.

Stufe 3

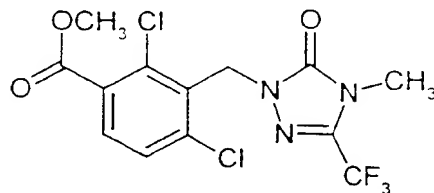
15

4 g 2-Brommethyl-4-trifluormethyl-benzoesäure-ethylester (ca. 70%ig) und 2.28 g
(12,8 mMol) 5-Brom-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 150 ml
Acetonitril gelöst, mit 5,3 g (38,4 mMol) Kaliumcarbonat versetzt und unter kräfti-
gem Rühren 2 Stunden zum Rückfluß erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird in Wasser
20 aufgenommen und mit Methylenchlorid mehrfach extrahiert. Die gesammelten
Methylenchlorid-Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, im Wasserstrahl-
vakuum eingeeengt und chromatographiert.

Man erhält 2 g (38 % der Theorie) 5-Brom-4-methyl-2-(2-ethoxycarbonyl-5-trifluor-methyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on als amorphes Produkt.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ): 5.46 ppm.

5 **Beispiel (IV-2)**



6,7 g (40 mMol) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 150 ml Acetonitril vorgelegt und mit 11 g (80 mMol) Kaliumcarbonat ver-
10 rührt. Nach Erwärmen der Mischung auf 50°C wird dann eine Lösung von 13,1 g (44 mMol) 3-Brommethyl-2,4-dichlor-benzoesäure-methylester in 20 ml Acetonitril unter Rühren tropfenweise dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird noch 15 Stunden unter Rühren zum Rückfluß erhitzt. Anschließend wird im Wasserstrahl-
15 vakuum eingeeengt, der Rückstand in Methylenchlorid aufgenommen, mit 1N-Salzsäure gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeeengt, der Rückstand mit Petrolether digeriert und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 14,9 g (97% der Theorie) 4-Methyl-5-trifluormethyl-2-(2,6-dichlor-3-
20 methoxycarbonyl-benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 109°C.

Analog zu den Beispielen (IV-1) und (IV-2) können beispielsweise auch die in der
25 nachstehenden Tabelle 3 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (IVa) hergestellt werden.

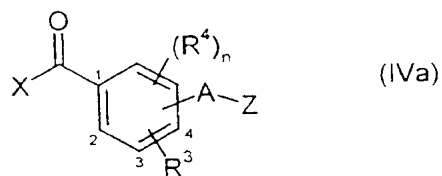
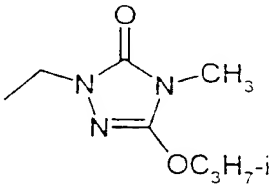
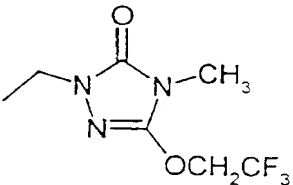
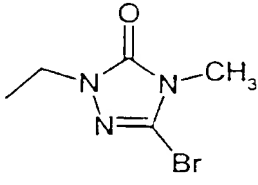
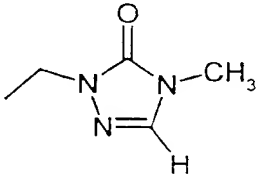
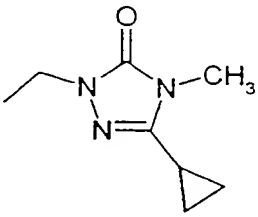
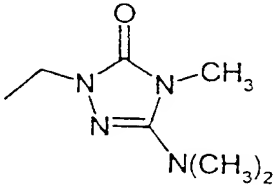
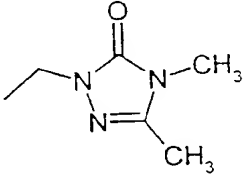
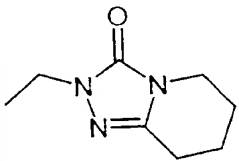
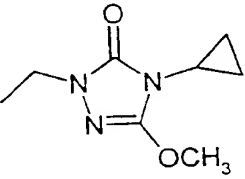
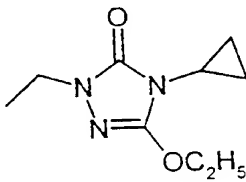
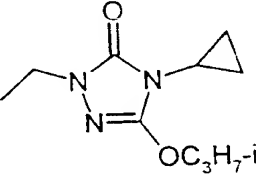
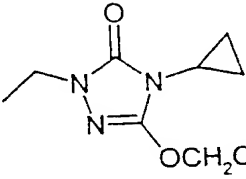
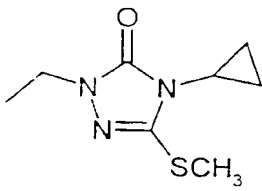
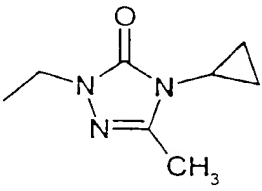
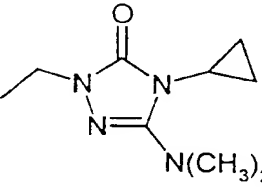
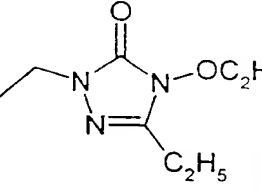
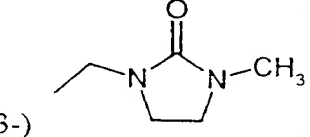
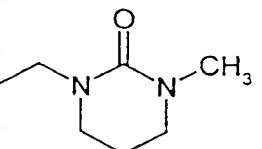


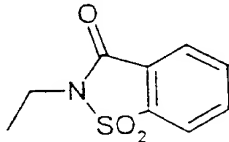
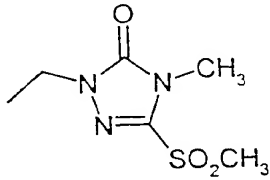
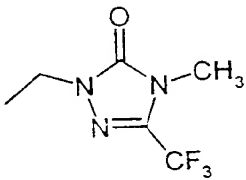
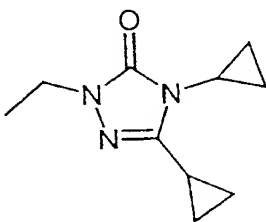
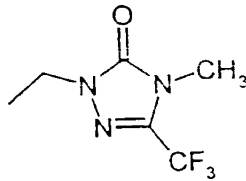
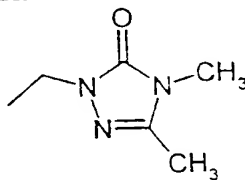
Tabelle 3: Beispiele für die Verbindungen der Formel (IV)

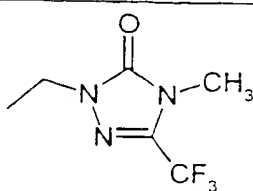
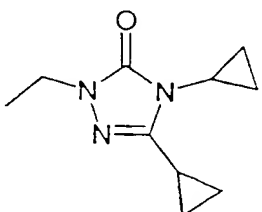
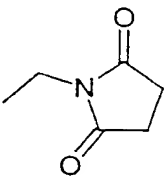
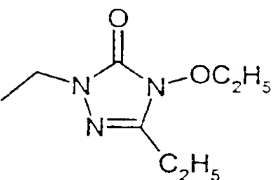
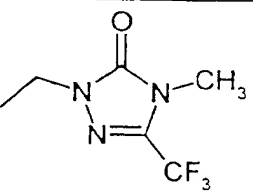
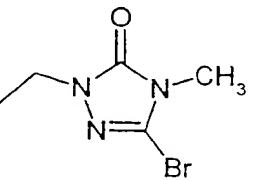
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-3	(2-) Cl	(4-) Cl	<p>(3-)</p>	OCH ₃	Fp.: 229°C logP = 2,27 ^{a)}
IV-4	(2-) Cl	(4-) Cl	<p>(3-)</p>	OCH ₃	Fp.: 120°C logP = 2,38 ^{a)}
IV-5	(2-) Cl	(4-) Cl	<p>(3-)</p>	OCH ₃	Fp.: 127°C logP = 2,55 ^{a)} -
IV-6	(2-) Cl	(4-) Cl	<p>(3-)</p>	OCH ₃	Fp.: 121°C logP = 2,04 ^{a)}

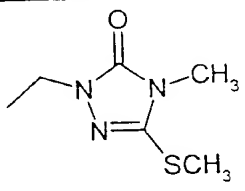
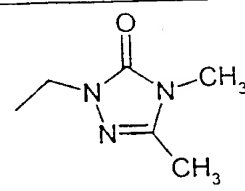
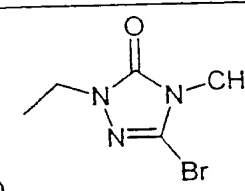
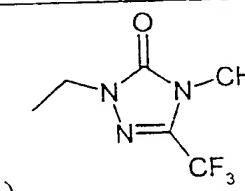
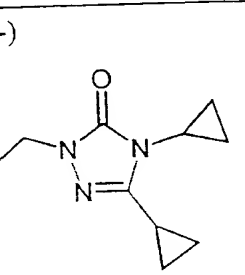
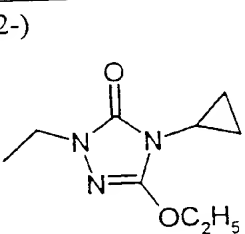
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-7	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 68°C logP = 2,73 ^{a)}
IV-8	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 129°C logP = 2,72 ^{a)}
IV-9	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 164°C logP = 2,18 ^{a)}
IV-10	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 158°C logP = 1,55 ^{a)}
IV-11	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 106°C logP = 2,16 ^{a)}
IV-12	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 126°C logP = 2,11 ^{a)}

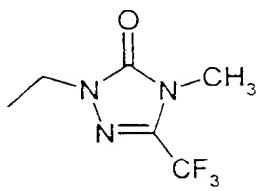
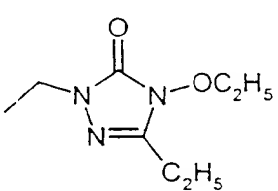
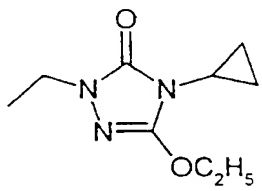
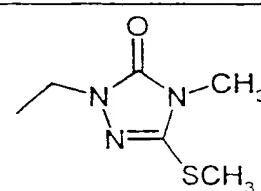
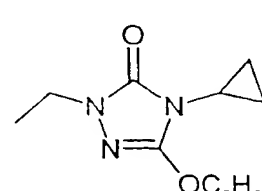
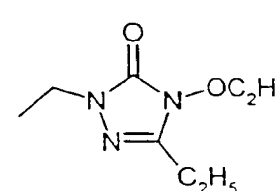
Bsp.- Nr.	(Position-) R^3	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-13	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 146°C logP = 1,65 ^{a)}
IV-14	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 178°C logP = 1,86 ^{a)}
IV-15	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 97°C logP = 2,36 ^{a)}
IV-16	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 99°C logP = 2,73 ^{a)}
IV-17	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 56°C logP = 3,08 ^{a)}
IV-18	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 102°C logP = 3,05 ^{a)}

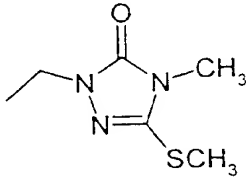
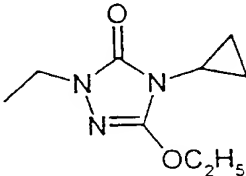
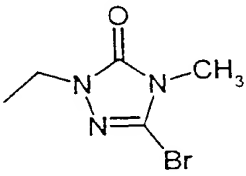
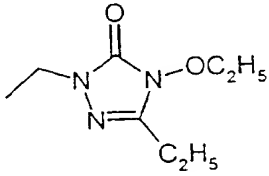
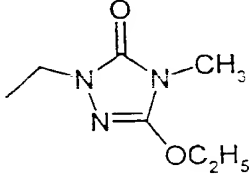
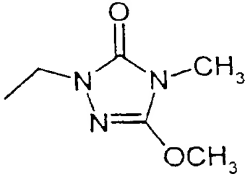
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-19	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 131°C logP = 2,70 ^{a)}
IV-20	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 135°C logP = 1,97 ^{a)}
IV-21	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 143°C logP = 2,42 ^{a)}
IV-22	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	Fp.: 85°C logP = 2,58 ^{a)} -
IV-23	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	logP = 1,98 ^{a)}
IV-24	(2-) Cl	(4-) Cl	(3-) 	OCH ₃	logP = 2,07 ^{a)}

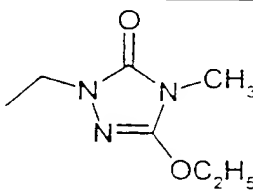
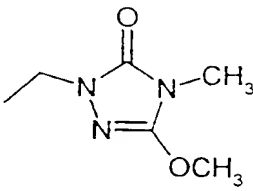
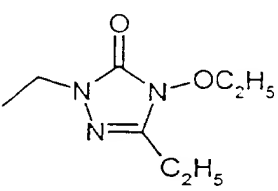
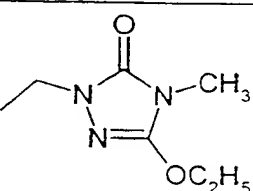
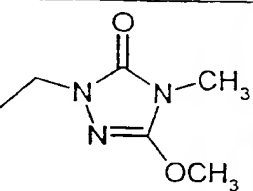
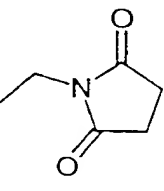
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-25	(2-) Cl	(4-) Cl	 (3-)	OCH ₃	Fp.: 157°C logP = 2,94 ^{a)}
IV-26	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,53 ppm.
IV-27	(4-) NO ₂	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,48 ppm.
IV-28	(4-) NO ₂	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,30 ppm.
IV-29	(4-) SO ₂ CH ₃	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,61 ppm.
IV-30	(4-) Cl	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,08 ppm.

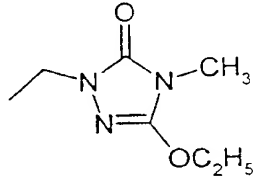
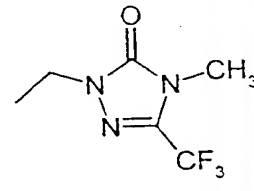
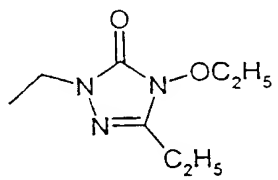
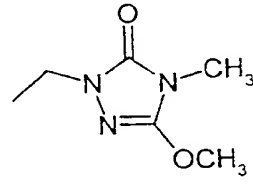
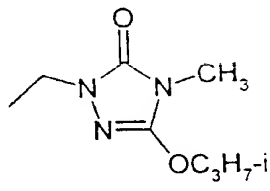
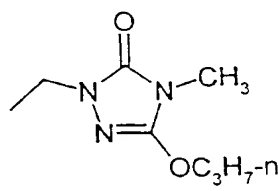
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-31	(4-) Cl	H	(3-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,17 ppm.
IV-32	(4-) Cl	H	(3-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,00 ppm
IV-33	(4-) SO ₂ CH ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 1,53 ^{a)}
IV-34	(4-) Br	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,24 ^{a)}
IV-35	(4-) Br	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,40 ^{a)}
IV-36	(4-) F	H	(3-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,41 ^{a)}

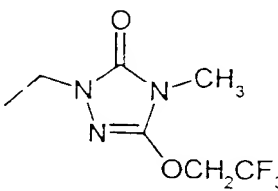
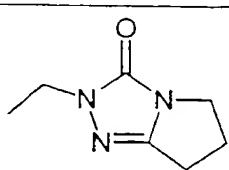
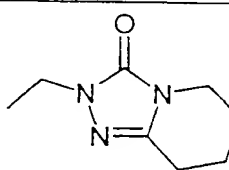
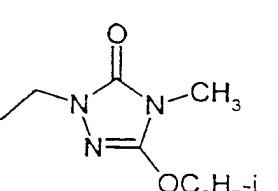
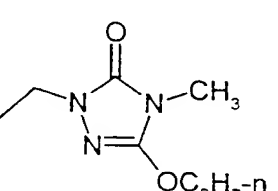
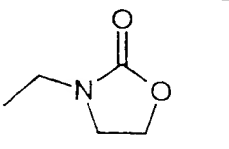
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-37	(4-) F	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,45 ^{a)}
IV-38	(4-) Br	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,06 ^{a)}
IV-39	(4-) Br	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,64 ^{a)}
IV-40	(4-) Br	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,23 ^{a)}
IV-41	(4-) Br	H	 (3-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,02 ^{a)}
IV-42	(4-) Cl	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,23 ^{a)}

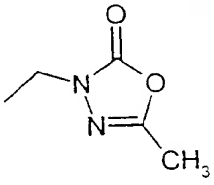
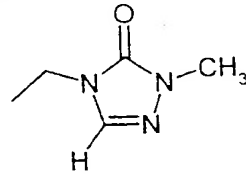
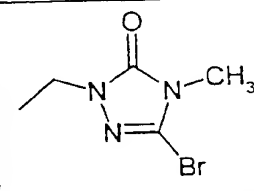
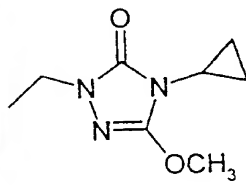
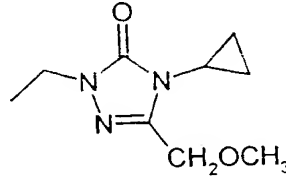
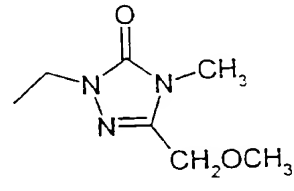
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-43	(4-) Cl	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,31 ^{a)}
IV-44	(4-) Cl	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,14 ^{a)}
IV-45	(4-) NO ₂	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,42 ^{a)}
IV-46	(4-) NO ₂	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,82 ^{a)}
IV-47	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,48 ^{a)}
IV-48	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,38 ^{a)}

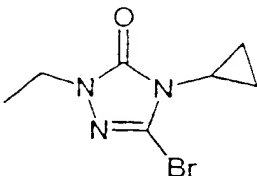
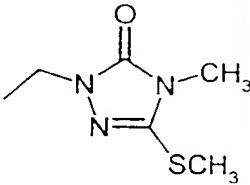
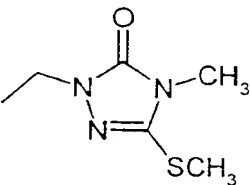
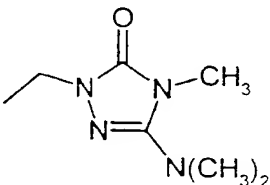
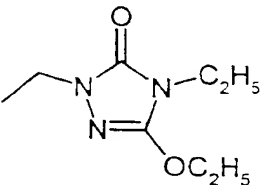
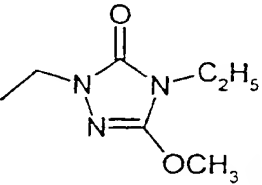
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-49	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,02 ^{a)}
IV-50	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₃ H ₇	logP = 3,91 ^{a)}
IV-51	(4-) OCH ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	
IV-52	(4-) OCH ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	
IV-53	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,37 ppm.
IV-54	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,37 ppm.

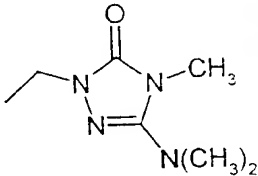
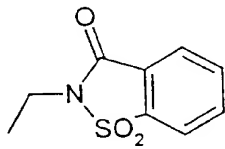
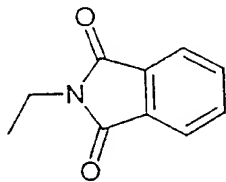
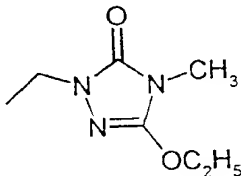
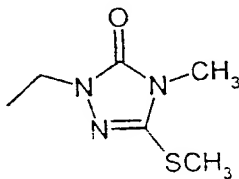
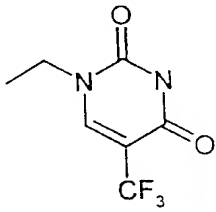
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-55	H	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	
IV-56	H	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,37 ppm.
IV-57	H	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,40 ppm.
IV-58	(4-) Br	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,95 ^{a)}
IV-59	(4-) Br	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,31 ppm.
IV-60	(4-) Br	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,44 ^{a)}

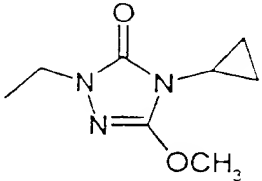
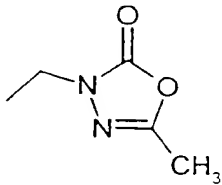
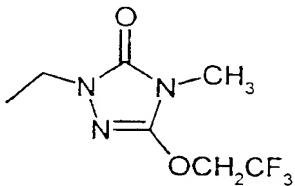
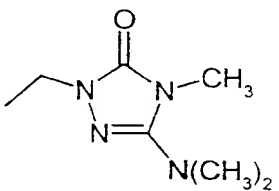
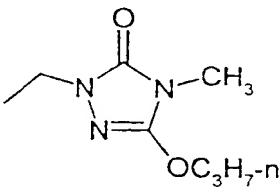
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-61	(4-) F	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,35 ppm.
IV-62	(4-) F	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,53 ppm.
IV-63	(4-) F	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,40 ppm.
IV-64	(4-) F	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,36 ppm.
IV-65	(4-) Br	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,34 ^{a)}
IV-66	(4-) Br	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 3,38 ^{a)}

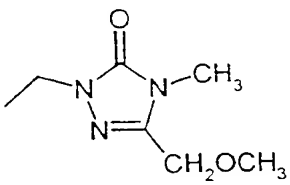
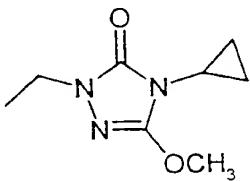
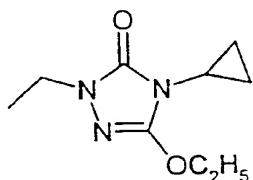
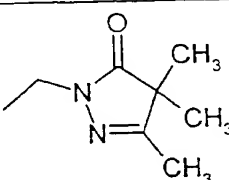
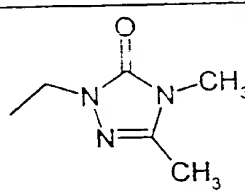
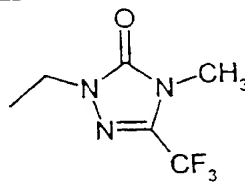
Bsp.- Nr.	(Position-) R^3	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-67	(4-) Br	H	(2-) 	OC_2H_5	$\log P = 3,31^a)$
IV-68	(4-) Br	H	(2-) 	OC_2H_5	$\log P = 2,16^a)$
IV-69	(4-) Br	H	(2-) 	OC_2H_5	$\log P = 2,41^a)$
IV-70	(4-) CF_3	H	(2-) 	OC_2H_5	$\log P = 3,51^a)$
IV-71	(4-) CF_3	H	(2-) 	OC_2H_5	$\log \bar{P} = 3,54^a)$
IV-72	(4-) Br	H	(2-) 	OC_2H_5	$\log P = 2,36^a)$

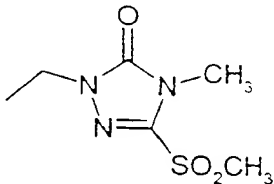
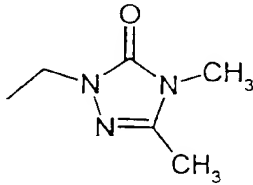
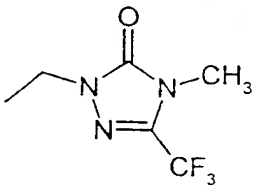
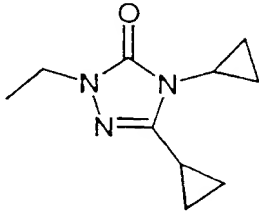
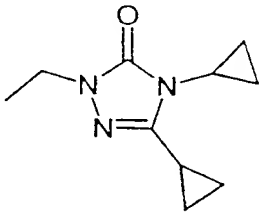
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-73	(4-) Br	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,88 ^{a)}
IV-74	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,68 ^{a)}
IV-75	(4-) Br	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,80 ^{a)}
IV-76	(4-) CF ₃	H	(3-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,87 ^{a)}
IV-77	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,88 ^{a)}
IV-78	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,60 ^{a)}

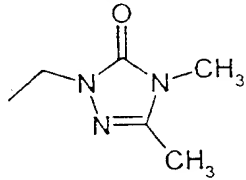
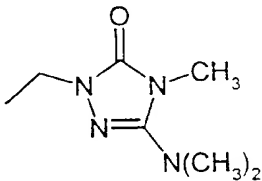
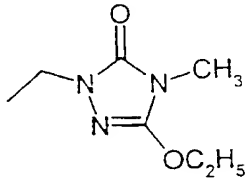
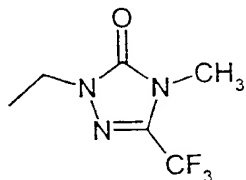
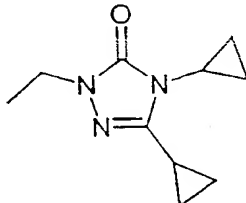
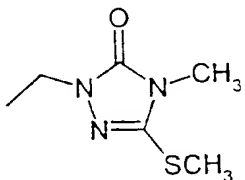
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-79	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3.35 ^{a)}
IV-80	(4-) Br	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2.86 ^{a)}
IV-81	(4-) Cl	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2.83 ^{a)}
IV-82	(4-) Br	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2.60 ^{a)}
IV-83	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,36 ppm.
IV-84	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,37 ppm.

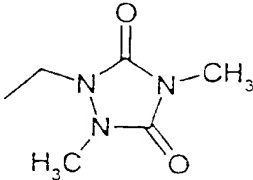
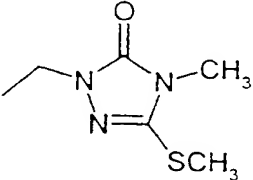
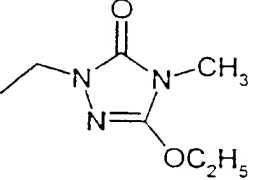
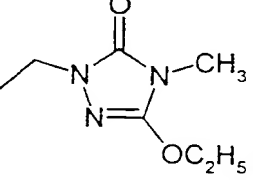
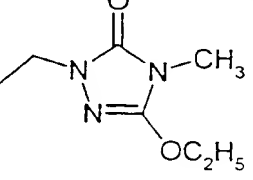
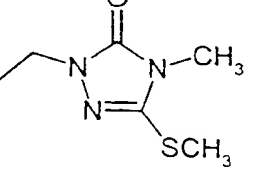
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-85	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,79 ^{a)}
IV-86	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,67 ^{a)}
IV-87	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,80 ^{a)}
IV-88	(3-) CH ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,54 ^{a)}
IV-89	(4-) SO ₂ CH ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 1,82 ^{a)}
IV-90	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,93 ^{a)}

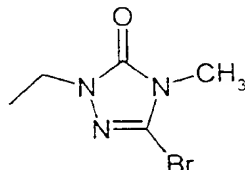
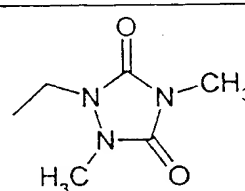
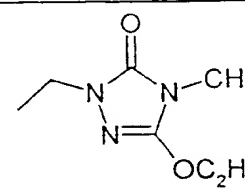
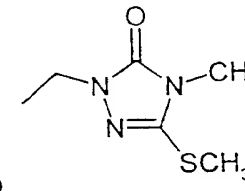
Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-91	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,08 ^{a)}
IV-92	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,04 ^{a)}
IV-93	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 3,45 ^{a)}
IV-94	(4-) F	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,21 ^{a)}
IV-95	(4-) F	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,96 ^{a)}

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV-96	(4-) F	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,05 ^{a)}
IV-97	(4-) F	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,50 ^{a)}
IV-98	(4-) F	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,89 ^{a)}
IV-99	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,91 ^{a)}
IV- 100	(4-) Cl	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,39 ppm.
IV- 101	(4-) Cl	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,50 ppm.

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV- 102	(4-) Cl	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,49 ppm.
IV- 103	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,29 ppm.
IV- 104	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,53 ppm.
IV- 105	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,34 ppm.
IV- 106	(4-) SO ₂ CH ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃ , δ): 5,39 ppm.

Bsp.- Nr.	(Position-) R^3	(Position-) $(R^4)_n$	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV- 107	(4-) SO_2CH_3	H	 (2-)	OC_2H_5	1H -NMR ($CDCl_3$, δ): 5,43 ppm.
IV- 108	(4-) SO_2CH_3	H	 (2-)	OC_2H_5	1H -NMR ($CDCl_3$, δ): 5,40 ppm.
IV- 109	(4-) SO_2CH_3	H	 (2-)	OC_2H_5	1H -NMR ($CDCl_3$, δ): 5,38 ppm.
IV- 110	(4-) Br	H	 (2-)	OC_2H_5	1H -NMR ($CDCl_3$, δ): 5,49 ppm.
IV- 111	H	H	 (2-)	OC_2H_5	1H -NMR ($CDCl_3$, δ): 5,3 ppm.
IV- 112	H	H	 (2-)	OC_2H_5	1H -NMR ($CDCl_3$, δ): 5,44 ppm.

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV- 113	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OC ₂ H ₅	logP = 2,58 ^{a)}
IV- 114	(4-) SO ₂ CH ₃	H	(2-) 	OCH ₃	logP = 1,53 ^{a)}
IV- 115	(4-) SO ₂ CH ₃	H	(2-) 	OCH ₃	logP = 1,59 ^{a)}
IV- 116	(4-) I	H	(2-) 	OCH ₃	logP = 2,68 ^{a)}
IV- 117	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OCH ₃	logP = 2,74 ^{a)}
IV- 118	(4-) CF ₃	H	(2-) 	OCH ₃	logP = 2,65 ^{a)}

Bsp.- Nr.	(Position-) R ³	(Position-) (R ⁴) _n	(Position-) -A-Z	X	Physikal. Daten
IV- 119	(4-) CF ₃	H	 (2-)	OC ₂ H ₅	logP = 2,96 ^{a)}
IV- 120	H	H	 (2-)	OCH ₃	Fp.: 106°C
IV- 121	(2-) NO ₂	(3-) OCH ₃	 (4-)	OCH ₃	logP = 2,27 ^{a)}
IV- 122	(2-) NO ₂	(3-) OCH ₃	 (4-)	OCH ₃	logP = 2,19 ^{a)}

Die Bestimmung der in den Tabellen angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in den Tabellen mit ^{a)} markiert.

(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in den Tabellen mit b) markiert.

- 5 Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).
- 10 Die λ -max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

5 Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, daß die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20 Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

25 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
 100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1 und 10 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais,
30 starke Wirkung gegen Unkräuter.

Tabelle A: Pre en. -nce-Test/Gewächshaus

Wirkstoff gemäß

Herstellungsbeispiel-Nr.

Aufwand-
menge (g ai./ha)

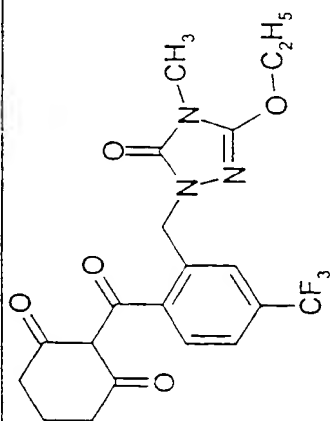
Mais

Cyperus

Abutilon

Amaranthus

Sinapis



(1)

100

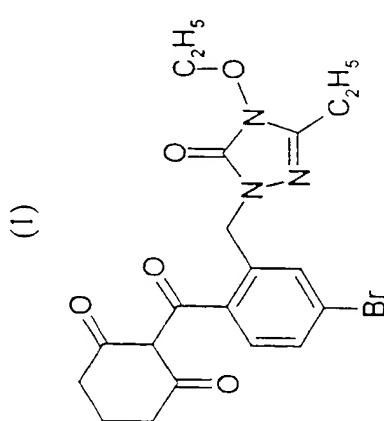
100

100

100

-

1000



(10)

90

100

90

100

0

500

Beispiel B

Post-emergence-Test

- 5 Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

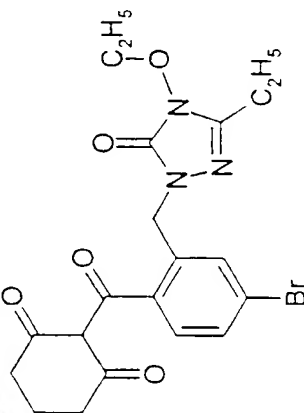
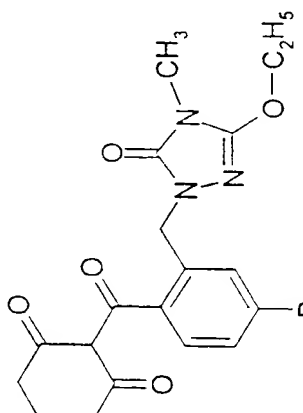
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene
10 Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in
15 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.
Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

- 20 Es bedeuten:
- 0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

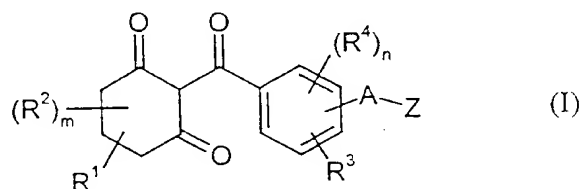
In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel
25 10 und 15 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais, starke Wirkung gegen Unkräuter.

Tabelle B: Post emergence-Test/Gewächshaus

Wirkstoff gemäß Herstellungsbeispiel-Nr.	Aufwand- menge (g ai./ha)	Mais	Ama- ranthus	Sinapis	Xanthium
 (10)	500	20	95	80	95
 (15)	1000	0	90	80	90

Patentansprüche

1. Substituierte Benzoylcyclohexandione der allgemeinen Formel (I).



5

in welcher

m für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

10

n für die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 steht,

A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) steht,

15

R¹ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxycarbonyl steht,

20

R² für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht, oder zusammen mit R¹ für Alkandiyl (Alkylen) steht, wobei in diesem Fall m für 1 steht und R¹ und R² am gleichen Kohlenstoffatom („geminal“) oder an zwei benachbarten Kohlenstoffatomen („vicinal“) stehen,

25

R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht,

- 5
10
15
20
25
30
- R⁴ Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl steht, und
- Z für eine gegebenenfalls substituierte 4- bis 12-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische, heterocyclische Gruppierung steht, welche 1 bis 4 Heteroatome (bis zu 4 Stickstoffatome und gegebenenfalls - alternativ oder additiv - ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom, oder eine SO-Gruppierung oder eine SO₂-Gruppierung) enthält, und welche zusätzlich ein bis drei Oxo-Gruppen (C=O) und/oder Thioxo-Gruppen (C=S) als Bestandteile des Heterocyclus enthält,
- einschließlich aller möglichen tautomeren Formen der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und der möglichen Salze der Verbindungen der allgemeinen Formel (I).
2. Substituierte Benzoylcyclohexandione gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,
- n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,
- A für eine Einfachbindung oder für Alkandiyl (Alkylen) mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- R¹ für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl

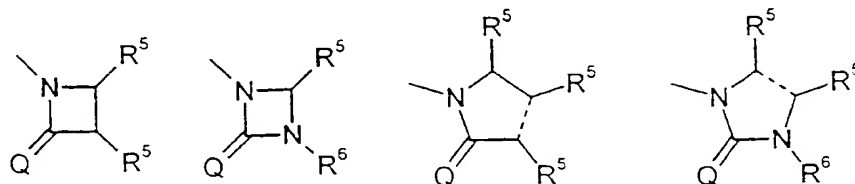
substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für Alkoxy-carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht.

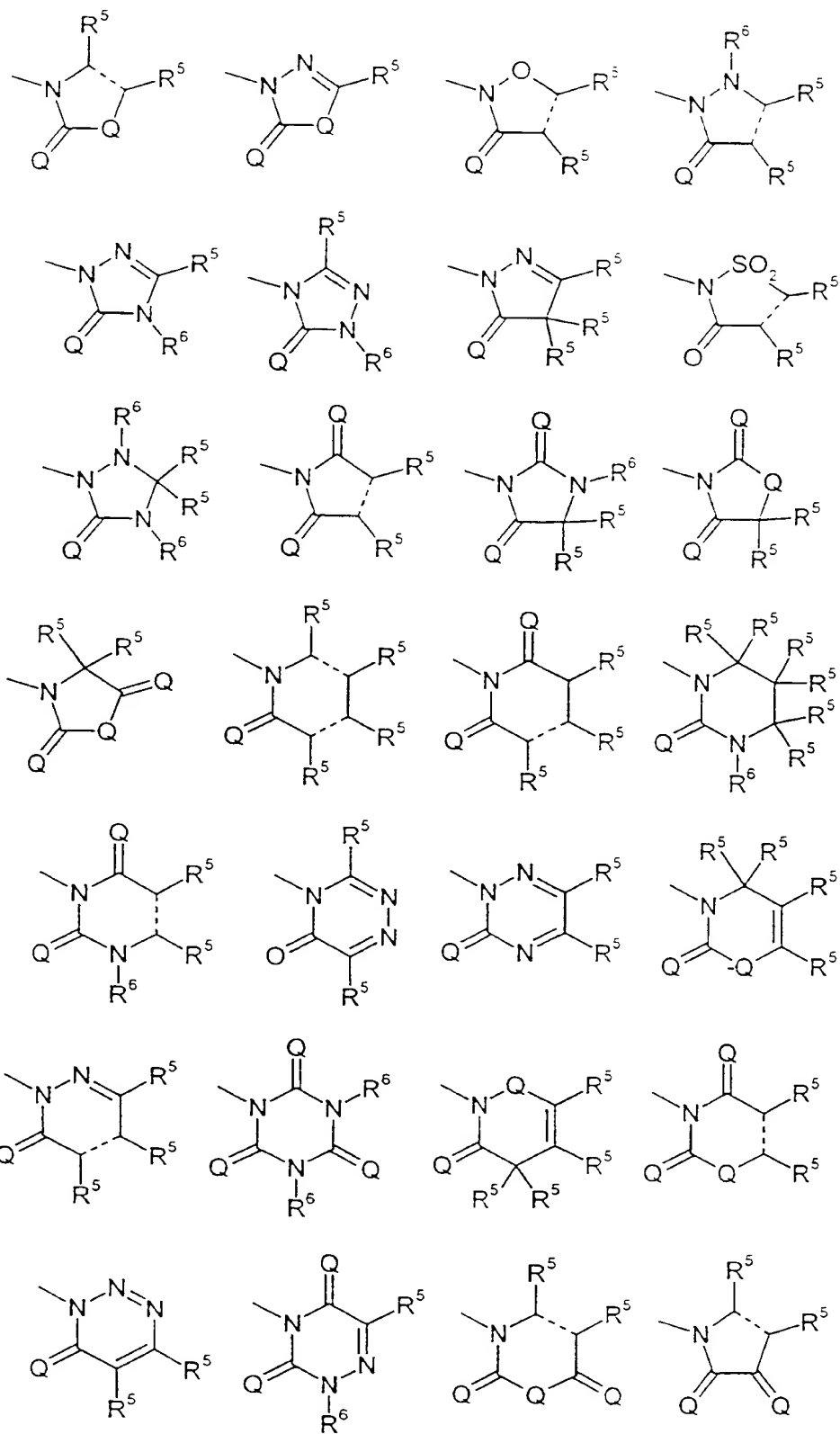
R^2 für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, oder zusammen mit R^1 für Alkandiyol (Alkylen) mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen steht, wobei in diesem Fall m für 1 steht und R^1 und R^2 am gleichen Kohlenstoffatom („geminal“) oder an zwei benachbarten Kohlenstoffatomen („vicinal“) stehen,

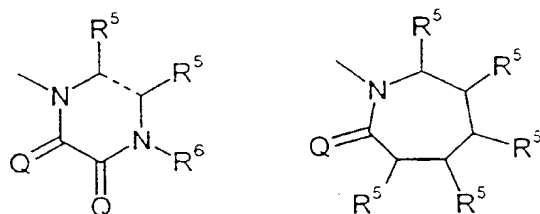
R^3 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht,

R^4 für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für Alkylamino, Dialkylamino oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen steht, und

Z für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht







worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfach-
bindung oder eine Doppelbindung ist,

5

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10

15

20

25

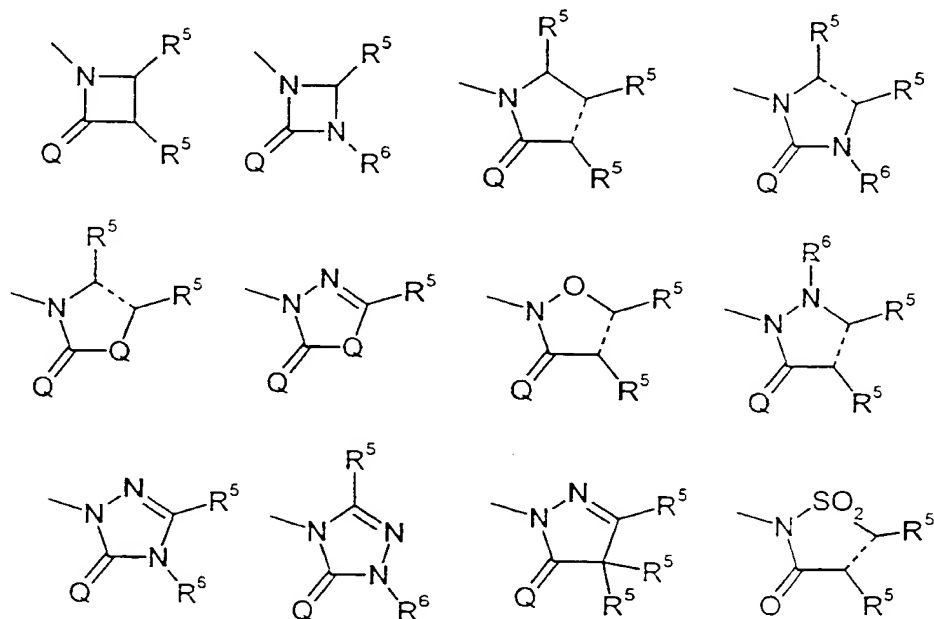
R⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Halogen, für je-
weils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-
Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl
substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl,
Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils bis zu
6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gege-
benenfalls durch Halogen substituiertes Alkylamino oder Di-
alkylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den
Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen sub-
stituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkenylthio oder
Alkenylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den
Alkenyl- bzw. Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls
durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl,
Cycloalkyloxy, Cycloalkylthio oder Cycloalkylamino mit
jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen
und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil,
oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl
oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl, Phenyl-
oxy, Phenyl-
thio, Phenylamino, Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder
Benzylamino steht, und

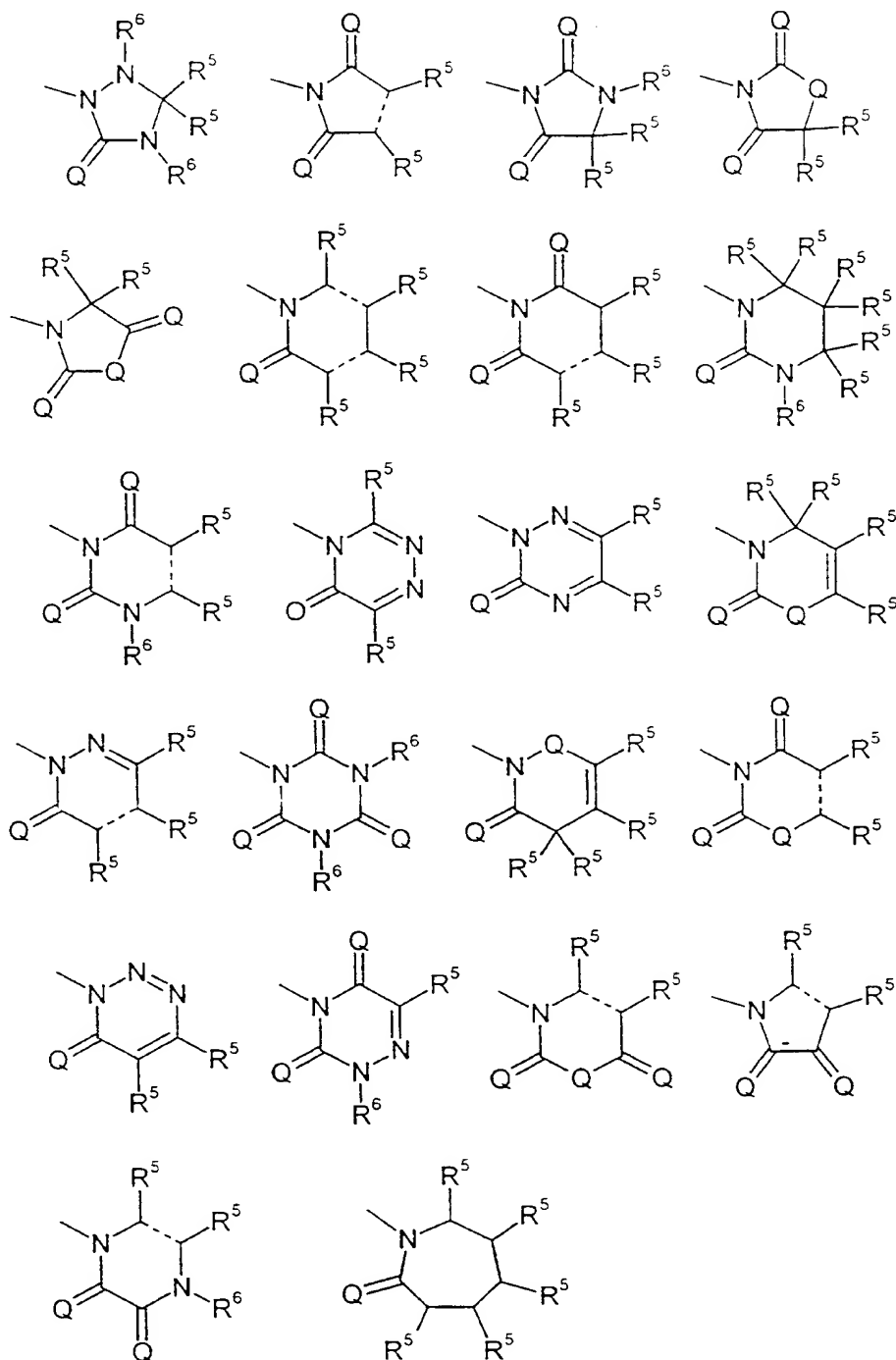
- 5
10
15
20
- R^6 für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkylidenamino mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino oder Alkanoylamino mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkinyl oder Alkenyloxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- bzw. Alkinylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylamino mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls bis zu 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R^5 oder R^6 für gegebenenfalls durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Alkandiyl mit 3 bis 5 Kohlenstoffatomen steht, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R^5 und R^5 sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R^5 auch für eine Benzo-
gruppierung steht.
- 25
3. Substituierte Benzoylcyclohexandione gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- 30
- m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,
- n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,
- A für eine Einfachbindung, Methylen, Ethyliden (Ethan-1,1-diyl) oder Dimethylen (Ethan-1,2-diyl) steht,

- 5
10
15
20
25
30
- R^1 für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, oder für Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl steht,
- R^2 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder zusammen mit R^1 für Methylen, Ethan-1,1-diyl (Ethyliden, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$), Ethan-1,2-diyl (Dimethylen, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$), Propan-1,3-diyl (Trimethylen, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$) oder Pentan-1,5-diyl (Pentamethylen, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$) steht, wobei in diesem Fall m für 1 steht und R^1 und R^2 am gleichen Kohlenstoffatom („geminal“) oder an zwei benachbarten Kohlenstoffatomen („vicinal“) stehen,
- R^3 für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht,

- 5
10
15
- R⁴ für Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl steht, und

- 15
- Z für eine der nachstehenden heterocyclischen Gruppierungen steht





5

worin jeweils die gestrichelt gezeichnete Bindung eine Einfachbindung oder eine Doppelbindung ist,

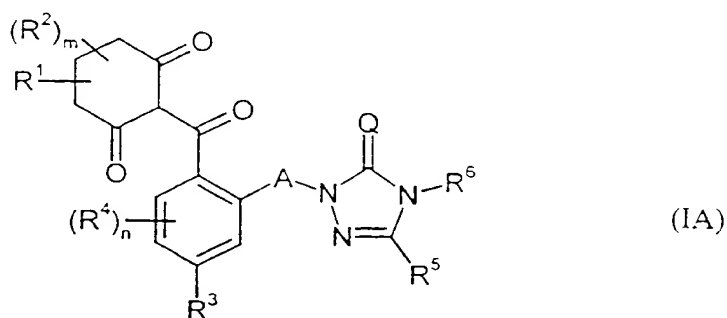
10

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

5 R⁵ für Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, 10 Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, für Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino oder Di-i-propylamino, für 15 jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylthio, Butenylthio, Propenylamino oder Butenylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, 20 Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino oder Cyclohexylamino, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Phenylthio, Phenylamino, 25 Benzyl, Benzyloxy, Benzylthio oder Benzylamino steht. und 30

R⁶ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i- oder s-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylamino, Ethylamino oder Dimethylamino, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Ethenyl, Propenyl, Ethinyl, Propinyl oder Propenyloxy, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Phenyl oder Benzyl steht, oder zusammen mit einem benachbarten Rest R⁵ oder R⁶ für jeweils gegebenenfalls durch Methyl und/oder Ethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen) oder Butan-1,4-diyl (Tetramethylen) steht, oder - für den Fall, daß zwei benachbarte Reste R⁵ und R⁵ sich an einer Doppelbindung befinden - zusammen mit dem benachbarten Rest R⁵ auch für eine Benzo-
gruppierung steht.

4. Substituierte Benzoylcyclohexandione gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die allgemeine Formel (IA),



5 in welcher

m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

10

A für eine Einfachbindung oder für Methylen steht,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15

R¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R² für Methyl steht,

20

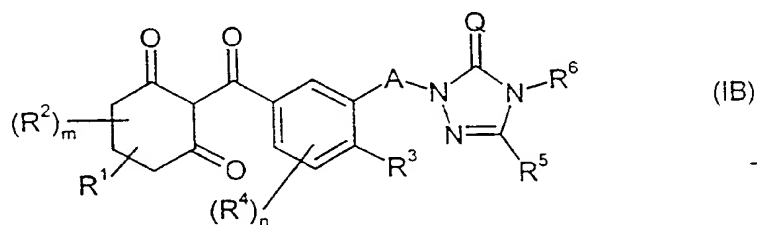
R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Tri-
fluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinyl-
methyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy,
Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl,
Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

R⁴ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

R⁵ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Cyclopropyl steht, und

R⁶ für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy oder Cyclopropyl steht.

5. Substituierte Benzoylcyclohexandione gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die allgemeine Formel (IB),



in welcher

m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

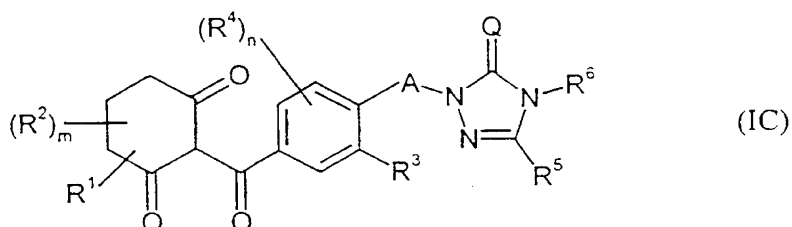
n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

A für eine Einfachbindung oder für Methylen steht,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

- 5
10
15
20
25
- R¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,
- R² für Methyl steht,
- R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Tri-
fluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinyl-
methyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy,
Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl,
Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,
- R⁴ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl,
Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methyl-
sulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy,
Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl,
Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,
- R⁵ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy,
n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio,
Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methyl-
sulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Cyclopropyl
steht, und
- R⁶ für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy oder Cyclopropyl steht.

- 6. Substituierte Benzoylcyclohexandione gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die allgemeine Formel (IC),



5 in welcher

m für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

10

A für eine Einfachbindung oder für Methylen steht,

Q für Sauerstoff oder Schwefel steht,

15

R¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht,

R² für Methyl steht,

20

R³ für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Tri-
fluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinyl-
methyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy,
Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl,
Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

25

R⁴ für Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Methylthiomethyl, Methylsulfinylmethyl, Methylsulfonylmethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy,

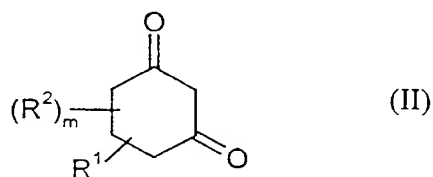
Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht.

5 R^5 für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, oder für Cyclopropyl steht, und

10 R^6 für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy oder Cyclopropyl steht.

7. Substituierte Benzoylcyclohexandione gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß es sich bei den Salzen um die Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C_1 - C_4 -Alkyl-ammonium-,
15 Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-ammonium-, Tri-(C_1 - C_4 -alkyl)-ammonium-, Tetra-(C_1 - C_4 -alkyl)-ammonium, Tri-(C_1 - C_4 -alkyl)-sulfonium-, C_5 - oder C_6 -Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C_1 - C_2 -alkyl)-benzyl-ammonium-Salze handelt.

8. Verfahren zum Herstellen von substituierten Benzoylcyclohexandionen
20 gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß man 1,3-Cyclohexandion oder dessen Derivate der allgemeinen Formel (II),

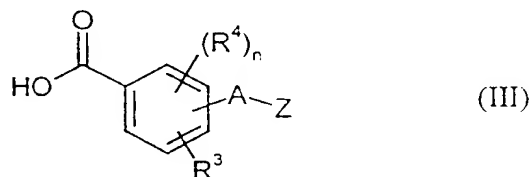


in welcher

25

m , R^1 und R^2 die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

mit substituierten Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III),



in welcher

5

n , A , R^3 , R^4 und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

10

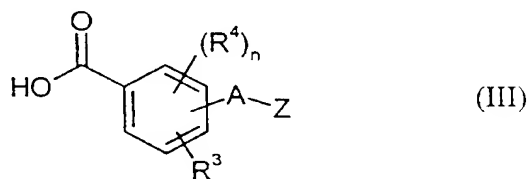
in Gegenwart eines Dehydratisierungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt,

15

und gegebenenfalls im Anschluß daran an den so erhaltenen Verbindungen der Formel (I) im Rahmen der Substituentendefinition auf übliche Weise elektrophile oder nucleophile bzw. Oxidations- oder Reduktionsreaktionen durchführt oder die Verbindungen der Formel (I) auf übliche Weise in Salze überführt.

9. Substituierte Benzoesäuren der allgemeinen Formel (III),

20



in welcher

n, A, R³, R⁴ und Z die in einem der Ansprüche 1 bis 6 angegebene Bedeutung haben,

5
ausgenommen die Verbindungen 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4-difluor-methyl-5-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on und 2-(5-Carboxy-2,4-dichlor-phenyl)-4,5-dimethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on.

- 10
10. Verwendung von mindestens einem substituierten Benzoylcyclohexandion gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.
11. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch den Gehalt von mindestens einem substituierten Benzoylcyclohexandion gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 und üblichen Streckmitteln.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter: Application No

PCT/EP 99/04929

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D249/12 C07D239/10 C07D231/20 C07D253/08 C07D285/12
C07D263/58 C07D233/30 C07D237/32 A01N43/653

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 96 26200 A (BASF AG ;DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29 August 1996 (1996-08-29) cited in the application claims ----	1-11
Y	WO 97 46530 A (DU PONT ;TSENG CHI PING (US); PATEL KANU MAGANBHAI (US); RORER MOR) 11 December 1997 (1997-12-11) cited in the application claims ----	1-11
Y	DE 44 05 614 A (BAYER AG) 24 August 1995 (1995-08-24) cited in the application claims ----- -/--	9

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 November 1999

Date of mailing of the international search report

14/12/1999

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Chouly, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/04929

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
Y	EP 0 617 026 A (BAYER AG) 28 September 1994 (1994-09-28) cited in the application claims ---	9
Y	EP 0 597 360 A (BAYER AG) 18 May 1994 (1994-05-18) cited in the application claims ---	9
Y	EP 0 370 332 A (BAYER AG) 30 May 1990 (1990-05-30) claims & DE 38 39 480 A cited in the application ---	9
Y	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 100, no. 25, 18 June 1984 (1984-06-18) Columbus, Ohio, US; abstract no. 209881, NIHON NOHYAKU CO. LTD.: "1,2,4-Triazolin-5-one derivatives" XP002124210 cited in the application abstract & JP 58 225070 A ---	9
Y	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 113, no. 3, 16 July 1990 (1990-07-16) Columbus, Ohio, US; abstract no. 23929, MURAI T. ET AL.: "Preparation of Delta 2-1,2,4-triazolin-5-one derivatives as antiinflammatory agents" XP002124211 cited in the application abstract & JP 02 015069 A (KAKEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) ---	9
P, Y	WO 99 07688 A (DEYN WOLFGANG VON :HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 18 February 1999 (1999-02-18) cited in the application claims -----	1-11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

Intern. Application No

PCT/EP 99/04929

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9626200 A	29-08-1996	AT 185139 T	15-10-1999
		AU 703623 B	25-03-1999
		AU 4875396 A	11-09-1996
		BR 9607420 A	23-06-1998
		CA 2213124 A	29-08-1996
		CZ 9702672 A	13-05-1998
		DE 59603223 D	04-11-1999
		EP 0811005 A	10-12-1997
		HU 9901256 A	28-07-1999
		JP 11501010 T	26-01-1999
		NZ 302651 A	28-01-1999
		PL 321891 A	22-12-1997
WO 9746530 A	11-12-1997	AU 3297397 A	05-01-1998
		CA 2257196 A	11-12-1997
		EP 0922032 A	16-06-1999
DE 4405614 A	24-08-1995	AU 1808495 A	04-09-1995
		BR 9506928 A	09-09-1997
		CA 2183641 A	24-08-1995
		CN 1150421 A	21-05-1997
		WO 9522532 A	24-08-1995
		EP 0746550 A	11-12-1996
		JP 9509923 T	07-10-1997
		PL 315970 A	23-12-1996
EP 0617026 A	28-09-1994	DE 4309966 A	29-09-1994
		BR 9401300 A	08-11-1994
		CA 2119673 A	27-09-1994
		CN 1092770 A,B	28-09-1994
		DE 59403503 D	04-09-1997
		JP 6340639 A	13-12-1994
EP 0597360 A	18-05-1994	DE 4238125 A	19-05-1994
		BR 9304702 A	17-05-1994
		CA 2102750 A	13-05-1994
		CN 1090847 A,B	17-08-1994
		JP 7076578 A	20-03-1995
EP 0370332 A	30-05-1990	DE 3839480 A	31-05-1990
		DD 297963 A	30-01-1992
		DE 58907343 D	05-05-1994
		JP 2184675 A	19-07-1990
		JP 2735905 B	02-04-1998
		US 5006148 A	09-04-1991
		US 5554580 A	10-09-1996
JP 58225070 A	27-12-1983	NONE	
JP 02015069 A	18-01-1990	NONE	
WO 9907688 A	18-02-1999	AU 9156198 A	01-03-1999



INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Interr. Aktenzeichen

PCT/EP 99/04929

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D249/12 C07D239/10 C07D231/20 C07D253/08 C07D285/12
C07D263/58 C07D233/30 C07D237/32 A01N43/653

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Researchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Researchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die researchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 96 26200 A (BASF AG ; DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29. August 1996 (1996-08-29) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche	1-11
Y	WO 97 46530 A (DU PONT ; TSENG CHI PING (US); PATEL KANU MAGANBHAI (US); RORER MOR) 11. Dezember 1997 (1997-12-11) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche	1-11
Y	DE 44 05 614 A (BAYER AG) 24. August 1995 (1995-08-24) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche	9

-/-



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

29. November 1999

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

14/12/1999

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Chouly, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

err nales Aktenzeichen

PCT/EP 99/04929

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 617 026 A (BAYER AG) 28. September 1994 (1994-09-28) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche ---	9
Y	EP 0 597 360 A (BAYER AG) 18. Mai 1994 (1994-05-18) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche ---	9
Y	EP 0 370 332 A (BAYER AG) 30. Mai 1990 (1990-05-30) Ansprüche & DE 38 39 480 A in der Anmeldung erwähnt ---	9
Y	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 100, no. 25, 18. Juni 1984 (1984-06-18) Columbus, Ohio, US; abstract no. 209881, NIHON NOHYAKU CO. LTD.: "1,2,4-Triazolin-5-one derivatives" XP002124210 in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung & JP 58 225070 A ---	9
Y	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 113, no. 3, 16. Juli 1990 (1990-07-16) Columbus, Ohio, US; abstract no. 23929, MURAI T. ET AL.: "Preparation of Delta 2-1,2,4-triazolin-5-one derivatives as antiinflammatory agents" XP002124211 in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung & JP 02 015069 A (KAKEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) ---	9
P,Y	WO 99 07688 A (DEYN WOLFGANG VON ;HILL REGINA LUISE (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE) 18. Februar 1999 (1999-02-18) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche -----	1-11

INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Intern Kennzeichen

PCT/EP 99/04929

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9626200 A	29-08-1996	AT 185139 T AU 703623 B AU 4875396 A BR 9607420 A CA 2213124 A CZ 9702672 A DE 59603223 D EP 0811005 A HU 9901256 A JP 11501010 T NZ 302651 A PL 321891 A	15-10-1999 25-03-1999 11-09-1996 23-06-1998 29-08-1996 13-05-1998 04-11-1999 10-12-1997 28-07-1999 26-01-1999 28-01-1999 22-12-1997
WO 9746530 A	11-12-1997	AU 3297397 A CA 2257196 A EP 0922032 A	05-01-1998 11-12-1997 16-06-1999
DE 4405614 A	24-08-1995	AU 1808495 A BR 9506928 A CA 2183641 A CN 1150421 A WO 9522532 A EP 0746550 A JP 9509923 T PL 315970 A	04-09-1995 09-09-1997 24-08-1995 21-05-1997 24-08-1995 11-12-1996 07-10-1997 23-12-1996
EP 0617026 A	28-09-1994	DE 4309966 A BR 9401300 A CA 2119673 A CN 1092770 A,B DE 59403503 D JP 6340639 A	29-09-1994 08-11-1994 27-09-1994 28-09-1994 04-09-1997 13-12-1994
EP 0597360 A	18-05-1994	DE 4238125 A BR 9304702 A CA 2102750 A CN 1090847 A,B JP 7076578 A	19-05-1994 17-05-1994 13-05-1994 17-08-1994 20-03-1995
EP 0370332 A	30-05-1990	DE 3839480 A DD 297963 A DE 58907343 D JP 2184675 A JP 2735905 B US 5006148 A US 5554580 A	31-05-1990 30-01-1992 05-05-1994 19-07-1990 02-04-1998 09-04-1991 10-09-1996
JP 58225070 A	27-12-1983	KEINE	
JP 02015069 A	18-01-1990	KEINE	
WO 9907688 A	18-02-1999	AU 9156198 A	01-03-1999



1. The first part of the document is a list of the names of the persons who were present at the meeting. The names are listed in alphabetical order.